

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2001 年 7 月 5 日 (05.07.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/47890 A1

(51) 国際特許分類: **C07D 215/233**, 239/88,
401/12, 403/12, 405/12, A61K 31/47, 31/496, 31/5377,
31/505, 31/4709, 31/517, A61P 43/00, 9/10

[JP/JP]. 三輪篤史 (MIWA, Atsushi) [JP/JP]; 〒370-1295
群馬県高崎市宮原町3番地 麒麟麦酒株式会社 医薬
探索研究所内 Gunma (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/09157

(74) 代理人: 佐藤一雄, 外(SATO, Kazuo et al.); 〒100-0005
東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号
協和特許法律事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2000 年 12 月 22 日 (22.12.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL,
PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願平 11/377486
1999 年 12 月 24 日 (24.12.1999) JP
特願平 11/374494
1999 年 12 月 28 日 (28.12.1999) JP
特願2000/177790 2000 年 6 月 14 日 (14.06.2000) JP

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 麒麟
麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)
[JP/JP]; 〒104-8288 東京都中央区新川二丁目10番1号
Tokyo (JP).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

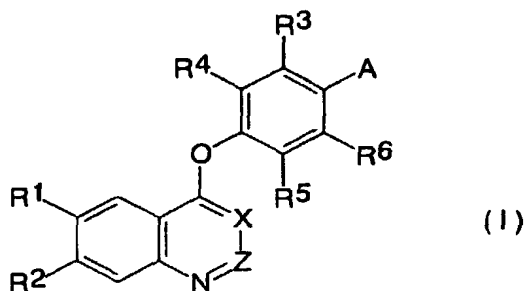
(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 酒井輝
行 (SAKAI, Teruyuki) [JP/JP]. 千賀照文 (SENGA,
Teruhumi) [JP/JP]. 古田孝之 (FURUTA, Takayuki)

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: QUINOLINE AND QUINAZOLINE DERIVATIVES AND DRUGS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: キノリン誘導体およびキナゾリン誘導体並びにそれらを含んでなる医薬



(57) Abstract: Compounds effective in the treatment of diseases caused via autophosphorylation of PDGF receptor, particularly compounds useful as intimal thickening inhibitor. Specifically, compounds of the general formula (I) or pharmacologically acceptable salts or solvates of the same wherein R¹ and R² are each hydrogen, alkyl, or the like; R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are each hydrogen, halogeno, alkyl, alkoxy, or the like; R¹¹ and R¹² are each hydrogen, alkyl, alkylcarbonyl, or the like; and A is a group represented by any of the general formulae (i) to (x), with the proviso that compounds of the general formula (I) wherein R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are each hydrogen and A is a group (v) (wherein u is 0 and R¹⁹ is phenyl which may be substituted with halogeno, alkyl, or alkoxy) are excepted.

[続葉有]



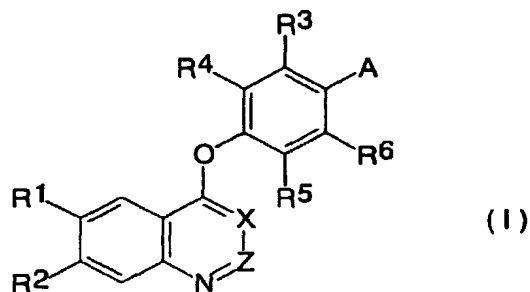
WO 01/47890 A1



(57) 要約:

P D G F 受容体の自己リン酸化により媒介される疾患の治療に用いることができる化合物、特に血管内膜肥厚を抑制する化合物、の提供。

式 (I) の化合物またはその薬理学上許容されうる塩もしくは溶媒和物。



(R¹およびR²は水素、アルキル等を表し、R³、R⁴、R⁵およびR⁶は、水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ等を表し、R¹¹およびR¹²は、水素、アルキル、アルキルカルボニル等を表し、Aは式 (i) ~ (x) のいずれかを表し、但しR³、R⁴、R⁵およびR⁶が水素であって、Aが基 (v) (uは0であり、R¹⁹はフェニル (ハロゲン、アルキル、またはアルコキシにより置換されていてもよい) である) を表す化合物は除かれる。)

明 細 書

キノリン誘導体およびキナゾリン誘導体並びにそれらを含んでなる医薬

発明の背景

発明の分野

本発明は、キノリン誘導体およびキナゾリン誘導体に関し、更に詳細には、PDGFレセプターの自己リン酸化と関連する疾患の治療に用いることができる、特に、血管狭窄を抑制する、キノリン誘導体およびキナゾリン誘導体に関する。

背景技術

PTCA（経皮的冠動脈形成術）は冠動脈狭窄によって発生する虚血性心疾患に対する有効な治療法として広く実施されている。しかし、PTCA施行後3～6ヶ月で約30%の頻度で認められる血管再狭窄が長期予後および医療経済上の大きな問題となっている。再狭窄の原因は、カテーテル治療時に発生する血管内膜、中膜の断裂、伸展刺激、血管内皮細胞傷害による血小板活性化などにより血管平滑筋細胞や血管外膜の線維芽細胞が活性化されて遊走・増殖し、傷害血管部位に過剰に蓄積することにあると考えられている。

従来よりこの血管平滑筋細胞、線維芽細胞活性化因子として種々の増殖因子が想定されてきたが、特にPDGF（血小板由来増殖因子）は、R.Rossらによる傷害反応仮説（N. Engl. J. Med., 295 369(1976)）以来、動脈硬化の原因因子のひとつとして着目され、再狭窄においても基礎、臨床の両面で主要な原因因子と考えられてきた（G.A.A.Ferns et. al. Science 253 1129 (1991)、M.G.Sirois et. al. Circulation 95 669 (1997)、M.Ueda et. al. Am. J. Pathol. 149 831 (1996) 等）。

PDGF-R（PDGF受容体）自己リン酸化阻害物質についてはこれまで複数の報告がある（WO 97/17329、The FASEB Journal, Vol.11, pp1119-1126(1997)）。

しかし、従来より報告されているPDGF受容体自己リン酸化阻害物質については、同じPDGF受容体ファミリーに属するVEGF受容体（KDRなど）や

c - k i t (S C F 受容体) に対する選択性については論じられていなかった。

V E G F は血管内皮細胞 (E C) の主要な増殖因子の一つであり、V E G F 受容体を阻害する物質は、傷害された血管における E C の再生を抑制して血栓の形成を促進し血管狭窄を亢進する可能性がある。

また、S C F は造血系の上流および腸管運動に関与する増殖因子であり、その受容体を抑制する物質は造血障害や腸管運動障害を誘発する可能性がある。

これらの理由から P D G F 受容体を c - k i t や K D R などに対して選択的に抑制する物質は副作用の少ない再狭窄防止薬として期待できる。

現在までに種々の再狭窄抑制薬の開発がなされているが、強い血管狭窄抑制作用を有する医薬は未だ開発されていないのが現状である。

発明の概要

本発明者らは、今般、P D G F 受容体自己リン酸化阻害活性を有する化合物を見いだした。

本発明者らはまた、ラット頸動脈バルーン傷害モデルおよびブタ冠動脈バルーン傷害モデルにおいて血管狭窄を抑制する化合物を見いだした。

本発明者らはさらにまた、P D G F 受容体自己リン酸化阻害活性が強く、かつ V E G F 受容体を阻害しない化合物を見出した。

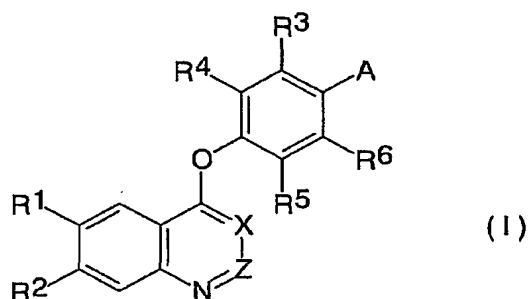
本発明者らはさらにまた、P D G F 受容体自己リン酸化阻害活性を有する化合物が低い c - k i t 自己リン酸化阻害活性を有することを見いだした。

本発明は、P D G F 受容体の自己リン酸化により媒介される疾患の治療に用いることができる化合物、特に、血管狭窄の抑制作用を有する化合物、を提供することをその目的とする。

本発明は、P D G F 受容体の自己リン酸化により媒介される疾患の治療に用いることができ、かつ c - k i t 自己リン酸化阻害作用に起因する副作用が低い化合物を提供することをその目的とする。

本発明による化合物は、式 (I) の化合物およびその薬理学上許容されうる塩および溶媒和物である：

3



(上記式中、

XおよびZは、同一または異なってもよく、CHまたはNを表し、

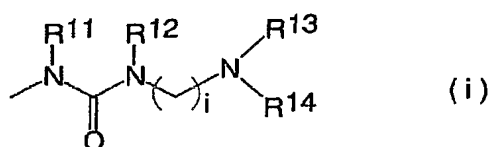
R¹およびR²は、同一または異なってもよく、水素原子またはハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルコキシを表し、

R³、R⁴、R⁵、およびR⁶は、同一または異なってもよく、水素原子、ハロゲン原子、ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキル、ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルコキシ、ニトロ、アミノ、またはモルホリルを表し、

Aは式(i)～(x)からなる群から選択される基を表し、

式(i)～(x)中において、R¹¹およびR¹²は、同一または異なってもよく、水素原子、ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキル、またはハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルカルボニルを表し、

但し、R³、R⁴、R⁵、およびR⁶が水素原子であって、Aが基(v)（ここで、uは0であり、R¹⁹はフェニル（ハロゲン原子、C₁₋₄アルキル、またはC₁₋₄アルコキシにより置換されていてもよい）である）を表す化合物は除かれる。



(上記式中、

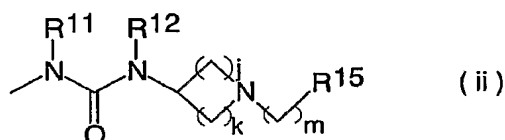
iは0～10の整数を表し、

R¹³およびR¹⁴は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子

により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル；またはハロゲン原子もしくは C_{1-4} アルキル（ハロゲン原子により置換されていてもよい）により置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{13} と R^{14} とはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5～7員の飽和または不飽和複素環（更に1以上の異種原子を含んでいてもよい）を形成していてもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-4} アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよく、

R^{13} または R^{14} は R^{12} と一緒にあってハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-4} アルキレンを形成していてもよい。）



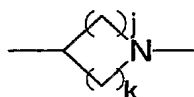
（上記式中、

jは0～3の整数を表し、

kは0～3の整数を表し、

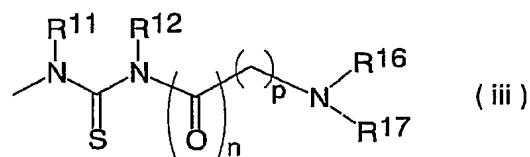
但し、jおよびkが同時に0を表すことはなく、

mは0～2の整数を表し、



の炭素原子は、1または2の同一または異なってもよいハロゲン原子により置換されていてもよい C_{1-4} アルキルにより置換されていてもよく、

R^{15} は、水素原子；ハロゲン原子により置換されていてもよい環状 C_{3-7} アルキル； C_{1-6} アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；または C_{1-4} アルコキシカルボニルを表す。）



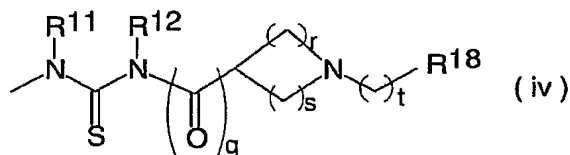
(上記式中、

n は0または1を表し、

p は 0 ~ 10 の整数を表し、

R¹⁶およびR¹⁷は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルカルボニル；C₁₋₄アルキル（ハロゲン原子により置換されていてもよい）により置換されていてもよい環状C₃₋₇アルキル；またはハロゲン原子もしくはC₁₋₄アルキル（ハロゲン原子により置換されていてもよい）により置換されていてもよいフェニルを表し、

R¹⁶とR¹⁷とはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5～7員の飽和または不飽和複素環（更に1以上の異種原子を含んでいてもよい）を形成していてもよく、この複素環は他の1または2の炭素環または複素環と縮合して10～12員の飽和または不飽和の二環性の炭素環または複素環あるいは10～15員の飽和または不飽和の三環性の炭素環または複素環を形成していてもよく、これらの複素環は酸素原子またはC₁₋₄アルキル（ハロゲン原子により置換されていてもよい）より置換されていてもよい。）



(上記式中、

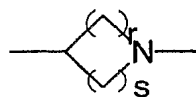
q は 0 または 1 を表し、

r は $0 \sim 3$ の整数を表し、

s は $0 \sim 3$ の整数を表し、

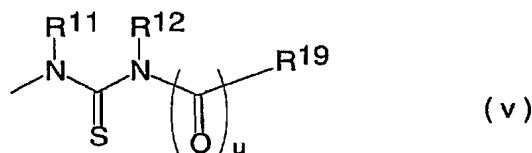
但し、 r および s が同時に 0 を表すことはなく、

t は 0 ～ 2 の整数を表し、



の炭素原子は、1 または 2 の同一または異なっているもよい C₁₋₄ アルキルにより置換されていてもよく、

R¹⁸ は、水素原子；C₁₋₆ アルキル（ハロゲン原子により置換されていてもよい）またはハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；またはハロゲン原子により置換されていてもよい C₁₋₄ アルコキシカルボニルを表す。）



（上記式中、

u は 0 または 1 を表し、

R¹⁹ は、

（1）フェニル（このフェニルは、ハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₁₀ アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₁₀ アルコキシ；-NR³¹R³²（R³¹およびR³²は同一または異なっているもよく水素原子またはハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₄ アルキルを表す）；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい）、

（2）フェノキシ（このフェノキシのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₁₀ アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₁₀ アルコキシ；-NR³¹R³²（R³¹およびR³²は前記と同義である）；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい）、

（3）環状 C₃₋₇ アルキル（この環状アルキルは他の炭素環または複素環と縮合して 8 ～ 12 員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成して

もよく、この炭素環および複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキル、ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル、ハロゲン原子により置換されていてもよい環状C₃₋₇アルキル、またはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(4) 5～7員の飽和または不飽和の複素環（この複素環は他の炭素環または複素環と縮合して10～12員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成していてもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(5) C₁₋₁₆アルキル、

(6) C₂₋₆アルケニル、または

(7) C₂₋₆アルキニル

を表し、

ここで、(5) C₁₋₁₆アルキル、(6) C₂₋₆アルケニル、および(7) C₂₋₆アルキニルは1以上の下記の子により置換されてもよい：

(a) フェニル（このフェニルは、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₁₀アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₁₀アルコキシ；-NR³¹R³²（R³¹およびR³²は前記と同義である）；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい）、

(b) フェノキシ（このフェノキシのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₁₀アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₁₀アルコキシ；-NR³¹R³²（R³¹およびR³²は前記と同義である）；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい）、

(c) フェニルチオ（このフェニルチオのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₁₀アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₁₀アルコキシ；-NR³¹R³²（R³¹およびR³²は前記と同義である）；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい）、

(d) -NR³³R³⁴（R³³およびR³⁴はR¹³およびR¹⁴で定義された内容と同義

である)、

(e) 環状C₃₋₇アルキル (この環状アルキルは他の炭素環または複素環と縮合して8~12員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成していてもよく、この炭素環および複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキル、ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル、またはハロゲン原子により置換されていてもよい。)、

(f) 5~7員の飽和または不飽和の複素環 (この複素環は他の炭素環または複素環と縮合して10~12員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成していてもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。)

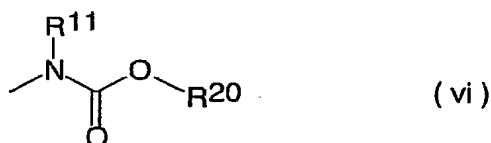
(g) ナフチル、

(h) シアノ、

(i) ハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルチオ、

(j) ハロゲン原子、または

(k) ハロゲン原子により置換されていてもよいアルコキシカルボニル。)



(上記式中、

R²⁰は、

(1) フェニル (このフェニルは、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル; ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ; -NR³⁵R³⁶

(R³⁵およびR³⁶は同一または異なってもよく水素原子またはハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₄アルキルを表す); ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル; ハロゲン原子; またはシアノにより置換されていてもよい)、

(2) 環状C₃₋₇アルキル (この環状アルキルは他の炭素環または複素環と縮合して8~12員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成していて

もよく、この炭素環および複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(3) 5～7員の飽和または不飽和の複素環（この複素環は他の炭素環または複素環と縮合して10～12員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成していてもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(4) C₁₋₂₀アルキル、

(5) C₂₋₆アルケニル、または

(6) C₂₋₆アルキニル

を表し、

ここで、(4) C₁₋₂₀アルキル、(5) C₂₋₆アルケニル、および(6) C₂₋₆アルキニルは1以上の下記の基により置換されてもよい：

(a) フェニル（このフェニルは、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ；-NR³⁵R³⁶

(R³⁵およびR³⁶は前記と同義である)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(b) フェノキシ（このフェノキシのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ；-NR³⁵R³⁶ (R³⁵およびR³⁶は前記と同義である)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(c) フェニルチオ（このフェニルチオのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ；-NR³⁵R³⁶ (R³⁵およびR³⁶は前記と同義である)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(d) -NR³⁷R³⁸ (R³⁷およびR³⁸はR¹³およびR¹⁴で定義された内容と同義である)、

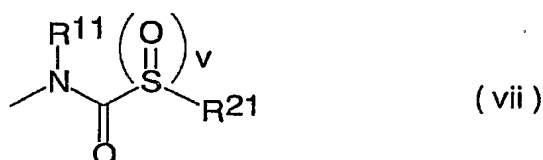
(e) 環状C₃₋₇アルキル（この環状アルキルは他の炭素環または複素環と縮合し

て 8 ～ 12 員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成していてもよく、この炭素環および複素環はハロゲン原子により置換されていてもよい C₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(f) 5 ～ 7 員の飽和または不飽和の複素環（この複素環は他の炭素環または複素環と縮合して 10 ～ 12 員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成していてもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよい C₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）

(g) ナフチル、または

(h) シアノ。)



(上記式中、

v は 0 ～ 2 の整数を表し、

R²¹ は、

(1) フェニル（このフェニルは、ハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₆アルコキシ；—NR³⁹R⁴⁰

(R³⁹およびR⁴⁰は同一または異なってもよく水素原子またはハロゲン原子により置換されてもよい C₁₋₄アルキルを表す)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(2) 環状 C₃₋₇アルキル（この環状アルキルは他の炭素環または複素環と縮合して 8 ～ 12 員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成していてもよく、この炭素環および複素環はハロゲン原子により置換されていてもよい C₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(3) 5 ～ 7 員の飽和または不飽和の複素環（この複素環は他の炭素環または複素環と縮合して 10 ～ 12 員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成してい

てもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(4) C₁₋₂₀アルキル、

(5) C₂₋₆アルケニル、または

(6) C₂₋₆アルキニル

を表し、

ここで、(4) C₁₋₂₀アルキル、(5) C₂₋₆アルケニル、および(6) C₂₋₆アルキニルは1以上の下記ของ基により置換されてもよい：

(a) フェニル（このフェニルは、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ；-NR³⁹R⁴⁰

(R³⁹およびR⁴⁰は前記と同義である)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(b) フェノキシ（このフェノキシのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ；-NR³⁹R⁴⁰ (R³⁹およびR⁴⁰は前記と同義である)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(c) フェニルチオ（このフェニルチオのフェニル部分は、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルキル；ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₆アルコキシ；-NR³⁹R⁴⁰ (R³⁹およびR⁴⁰は前記と同義である)；ハロゲン原子により置換されていてもよいフェニル；ハロゲン原子；またはシアノにより置換されていてもよい)、

(d) -NR⁴¹R⁴² (R⁴¹およびR⁴²はR¹³およびR¹⁴で定義された内容と同義である)、

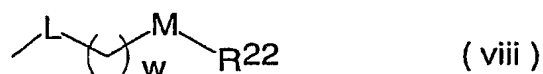
(e) 環状C₃₋₇アルキル（この環状アルキルは他の炭素環または複素環と縮合して8～12員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成していてもよく、この炭素環および複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。）、

(f) 5～7員の飽和または不飽和の複素環（この複素環は他の炭素環または複

素環と縮合して10～12員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成していてもよく、この複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルまたはハロゲン原子により置換されていてもよい。)

(g) ナフチル、または

(h) シアノ。)



(上記式中、

wは1～4の整数を表し、

Lは ---O--- 、 $\text{---S(=O)}_y\text{---}$ (yは0～2の整数を表す)、または $\text{---N(---R}^{11})\text{---}$ を表し、

Mは ---O--- 、 ---C(=O)---O--- 、 $\text{---S(=O)}_z\text{---}$ (zは0～2の整数を表す)、 $\text{---N(---R}^{12})\text{---}$ 、 $\text{---C(=O)---N(---R}^{12})\text{---}$ 、または ---C(=O)--- を表し、

R²²は、水素原子；C₁₋₄アルキル (ハロゲン原子により置換されていてもよい)；またはフェニル (ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₄アルキル、ハロゲン原子により置換されてもよいC₁₋₄アルコキシ、ニトロ、アミノ、またはハロゲン原子により置換されていてもよい)を表し、

Mが $\text{---N(---R}^{12})\text{---}$ または $\text{---C(=O)---N(---R}^{12})\text{---}$ であるときには、R²²とR¹²とはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5～7員の飽和または不飽和の複素環 (更に1以上の異種原子を含んでいてもよい)を形成していてもよく、この複素環は他の炭素環または複素環と縮合して10～12員の二環性の飽和または不飽和の複素環を形成していてもよく、これらの複素環はハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキル、フェニル、ベンジル、またはピペリジンにより置換されていてもよい。)

—OR²³

(ix)

(上記式中、R²³は水素原子、またはハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルを表す。)

—NR²⁴R²⁵

(x)

(上記式中、R²⁴およびR²⁵は、同一または異なってもよく、水素原子またはハロゲン原子により置換されていてもよいC₁₋₄アルキルを表す。)

本発明による化合物はPDGF受容体の自己リン酸化により媒介される疾患の治療に有用である。

発明の具体的説明

化合物

本明細書において、基または基の一部としての「アルキル」、「アルコキシ」、「アルケニル」、および「アルキニル」という語は、基が直鎖または分枝鎖のアルキル基、アルコキシ基、アルケニル基、およびアルキニル基を意味する。

C₁₋₆アルキルは、好ましくは、C₁₋₄アルキルである。

C₁₋₁₀アルキルは、好ましくは、C₁₋₈アルキルである。

C₁₋₁₆アルキルは、好ましくは、C₁₋₁₃アルキルである。

C₁₋₂₀アルキルは、好ましくは、C₁₋₁₈アルキルである。

C₁₋₆アルコキシは、好ましくは、C₁₋₄アルコキシである。

C₁₋₁₀アルコキシは、好ましくは、C₁₋₈アルコキシである。

C₂₋₆アルケニルは、好ましくは、C₂₋₄アルケニルである。

C₂₋₆アルキニルは、好ましくは、C₂₋₄アルキニルである。

C₁₋₆アルキルの例としては、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシルが挙げられる。

C₁₋₆アルコキシの例としては、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシが挙げられる。

C₂₋₆アルケニルの例としては、アリル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル基が挙げられる。

C₂₋₆アルキニルの例としては、2-プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基、ヘキシニル基が挙げられる。

本明細書において「により置換されているもよいアルキル」とは、アルキル上の1またはそれ以上の水素原子が1またはそれ以上の置換基（同一または異なっているもよい）により置換されたアルキルまたは非置換アルキルを意味する。置換基の最大数はアルキル上の置換可能な水素原子の数に依存して決定できることは当業者に明らかであろう。これらはアルキル以外の置換基を有する基についても同様である。

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、またはヨウ素原子を意味する。

飽和または不飽和の5～7員複素環は、酸素原子、窒素原子、および硫黄原子から選択される1またはそれ以上の異種原子を含む。飽和または不飽和の5～7員複素環式基の例としては、ピリジル、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピロリジニル、ピラゾリルが挙げられる。

5～7員の飽和または不飽和の複素環式基は他の飽和または不飽和の炭素環または複素環と縮合して10～12員の二環あるいは10～15員の三環を形成しているもよい。二環性の縮合環式基としては、インダニル、キノリル、キナゾリニルが挙げられる。三環性の縮合環式基としては、フェニチアジル、フェノキサジル、ジヒドロジベンゾアゼピニルが挙げられる。

環状C₃₋₇アルキルは他の飽和または不飽和の炭素環または複素環と縮合して8～12員の二環性の飽和または不飽和の炭素環または複素環を形成しているもよい。二環性の縮合環式基としては、インダニル、キノリル、キナゾリニルが挙げられる。

基 (i) において、i は、好ましくは 0～4、更に好ましくは 1～3、の整数を表す。

基 (i) の好ましい例としては、i が 1～3 の整数を表し、 R^{13} および R^{14} が同一または異なっているにもかかわらず C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒に becoming 5～7 員の飽和複素環（この複素環は C_{1-4} アルキルにより置換されていてもよい）を形成している場合が挙げられる。

基 (ii) において、j は、好ましくは 1～2 の整数を表す。k は好ましくは 1～2 の整数を表す。m は好ましくは 1～2 の整数を表す。

基 (ii) の好ましい例としては、j が 1 または 2 であり、k が 1 または 2 であり、m は 1 または 2 であり、 R^{15} が置換されていてもよいフェニルを表す場合が挙げられる。

基 (iii) において p は好ましくは 0～3 の整数を表す。

基 (iii) の好ましい例としては、n が 0 であり、p が 1～3 の整数を表し、 R^{16} および R^{17} が同一または異なっているにもかかわらず C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒に becoming 5～7 員の飽和複素環（この複素環は C_{1-4} アルキルまたは酸素原子により置換されていてもよい）を形成している場合が挙げられる。

基 (iii) の好ましい例としては、また、n が 1 であり、p が 0 である場合が挙げられる。

基 (iv) において r は好ましくは 1～2 の整数を表す。s は好ましくは 1～2 の整数を表す。t は好ましくは 0～1 の整数を表す。

基 (iv) の好ましい例としては、q が 0 であり、r が 1 または 2 であり、s が 1 または 2 であり、t は 1 または 2 であり、 R^{18} が置換されていてもよいフェニルを表す場合が挙げられる。

基 (v) において、 R^{19} が表すフェニルおよびフェノキシは、 C_{6-10} アルキルまたは C_{6-10} アルコキシ（好ましくは、 C_{6-8} アルキルまたは C_{6-8} アルコキシ、）により置換されていてもよい。

基 (v) において、 R^{19} が表すアルキル、アルケニル、およびアルキニルは、フェニル、フェノキシ、またはフェニルチオにより置換されていてもよく、この

フェニル、フェノキシ、またはフェニルチオは、 C_{6-10} アルキルまたは C_{6-10} アルコキシ（好ましくは、 C_{6-8} アルキルまたは C_{6-8} アルコキシ）により置換されているともよい。

基 (v) の好ましい例としては、 u が 1 であり、 R^{19} が置換されているともよいフェニルにより置換された C_{1-4} アルキルを表す場合が挙げられる。

基 (vi) の好ましい例としては、 R^{20} が置換されているともよいフェニルまたは C_{1-6} アルキル（置換されているともよいフェニルにより置換されているともよい）を表す）を表す場合が挙げられる。

基 (viii) において w は好ましくは 1 ~ 3 の整数を表す。

L が $-O-$ のとき、好ましくは、 M が $-O-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-N(-R^{12})-$ 、 $-C(=O)-N(-R^{12})-$ 、または $-C(=O)-$ を表す。また、 L が $-S(=O)_y-$ のとき、好ましくは、 M が $-O-$ を表す。 L が $-N(-R^{11})-$ のとき、好ましくは、 M が $-O-$ を表す。

基 (viii) の好ましい例としては、 w が 1 ~ 3 の整数を表し、 L が $-O-$ を表し、 M が $-O-$ または $-C(=O)-O-$ を表し、 R^{22} が置換されているともよいフェニルを表す場合が挙げられる。

本発明による式 (I) の化合物の好ましい例としては、下記の化合物が挙げられる：

X が CH または N を表し、 Z が CH を表す化合物、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 $R^3 \sim R^6$ のうち少なくとも一つが水素原子以外の基を表わす化合物、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 が水素原子以外の基を表わし、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表す化合物、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 A が基 (i) (i が 1 ~ 3 の整数を表し、 R^{13} および R^{14} は同一または異なっているともよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5 ~ 7 員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルにより置換されているともよい) を表す化合物（更に好ましくは、 X が CH または N を表し、 Z が CH を表す）、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 $R^3 \sim R^6$ が水素原子を表し、 A が基

(i) (i が 1～3 の整数を表し、 R^{13} および R^{14} は同一または異なっているとしてもよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5～7 員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルにより置換されていてもよい) を表す化合物 (更に好ましくは、X が CH または N を表し、Z が CH を表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 が水素原子以外の基を表わし、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表し、A が基 (i) (i が 1～3 の整数を表し、 R^{13} および R^{14} は同一または異なっているとしてもよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5～7 員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルにより置換されていてもよい) を表す化合物 (更に好ましくは、X が CH または N を表し、Z が CH を表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 がニトロを表わし、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表し、A が基 (i) (i が 1～3 の整数を表し、 R^{13} および R^{14} は同一または異なっているとしてもよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5～7 員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルにより置換されていてもよい) を表す化合物 (更に好ましくは、X が CH または N を表し、Z が CH を表す)、

X が N を表し、Z が CH を表し、 R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 がニトロを表わし、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表し、A が基 (i) (i が 2 であり、 R^{13} および R^{14} は同一または異なっているとしてもよく C_{2-3} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 6 員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルにより置換されていてもよい) を表す化合物

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、A が基 (ii) (j が 1 または 2 であり、k が 1 または 2 であり、m は 1 または 2 であり、 R^{15} が置換されていてもよいフェニルを表す) を表す化合物 (更に好ましくは、X が CH または N を表し、Z が CH を表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 $R^3 \sim R^6$ が水素原子を表わし、A が基 (ii) (j が 1 または 2 であり、k が 1 または 2 であり、m は 1 または 2 であり、 R^{15} が置換されていてもよいフェニルを表す) を表す化合物、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 が水素原子以外の基を表し、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表わし、Aが基(ii) (j が1または2であり、 k が1または2であり、 m は1または2であり、 R^{15} が置換されていてもよいフェニルを表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(iii) (n が0であり、 p が1~3の整数を表し、 R^{16} および R^{17} は同一または異なってもよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5~7員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルまたは酸素原子により置換されていてもよい)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 $R^3 \sim R^6$ が水素原子を表し、Aが基(iii) (n が0であり、 p が1~3の整数を表し、 R^{16} および R^{17} は同一または異なってもよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5~7員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルまたは酸素原子により置換されていてもよい)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 が水素原子以外の基を表わし、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表し、Aが基(iii) (n が0であり、 p が1~3の整数を表し、 R^{16} および R^{17} は同一または異なってもよく C_{1-4} アルキルを表すか、あるいはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって5~7員の飽和複素環を形成しており、この複素環は C_{1-4} アルキルまたは酸素原子により置換されていてもよい)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(iv) (q が0であり、 r が1または2であり、 s が1または2であり、 t は1または2であり、 R^{18} が置換されていてもよいフェニルを表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 $R^3 \sim R^6$ が水素原子を表わし、Aが基(iv) (q が0であり、 r が1または2であり、 s が1または2であり、 t は1

または2であり、 R^{18} が置換されていてもよいフェニルを表す)を表す化合物、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 が水素原子以外の基を表し、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表し、Aが基(iv) (q が0であり、 r が1または2であり、 s が1または2であり、 t は1または2であり、 R^{18} が置換されていてもよいフェニルを表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(v) (u が1であり、 R^{19} が置換されていてもよいフェニル、あるいは置換されていてもよいフェニルにより置換された C_{1-4} アルキルを表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 $R^3 \sim R^6$ が水素原子を表わし、Aが基(v) (u が1であり、 R^{19} が置換されていてもよいフェニル、あるいは置換されていてもよいフェニルにより置換された C_{1-4} アルキルを表す)を表す化合物、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^5 が水素原子以外の基を表し、 R^3 、 R^4 、および R^6 が水素原子を表し、Aが基(v) (u が1であり、 R^{19} が置換されていてもよいフェニル、あるいは置換されていてもよいフェニルにより置換された C_{1-4} アルキルを表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(vi) (R^{20} が置換されていてもよいフェニルまたは C_{1-6} アルキル(置換されていてもよいフェニルにより置換されていてもよい)を表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(vii) (R^{21} が置換されていてもよいフェニルまたは C_{1-6} アルキル(置換されていてもよいフェニルにより置換されていてもよい)を表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(viii) (w が1~3の整数を表し、Lが-O-を表し、Mが-O-または-C(=O)-O-を表し、 R^{22} が置換されていてもよいフェニルを表す)を表す化合物(更に好ましくは、XがC

HまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(viii)(Lが-O-のとき、Mが-O-、 $-C(=O)-O-$ 、 $-N(-R^{12})-$ 、 $-C(=O)-N(-R^{12})-$ 、または $-C(=O)-$ であり、Lが $-S(=O)_y-$ のとき、Mが-O-であり、Lが $-N(-R^{11})-$ のとき、Mが-O-である)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、Aが基(iii)(nが1であり、pが0である)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)、および

R^1 および R^2 が C_{1-4} アルコキシを表し、 R^3 がモルホルルを表し、 $R^4 \sim R^6$ が水素原子を表し、Aが基(x)を表す化合物(更に好ましくは、XがCHまたはNを表し、ZがCHを表す)。

本発明による化合物の特に好ましい例としては、実施例1~1209に記載された化合物が挙げられる。

本発明による化合物の特に好ましい例としては、実施例1~1209に記載された化合物に加えて下記の化合物が挙げられる：

N- {4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キナゾリニル) オキシ]-2-ニトロフェニル} -N-(4-ピペリジノブチル) ウレア、

N- {4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キナゾリニル) オキシ]-2-ニトロフェニル} -N-(3-ピペリジノプロピル) ウレア、

N-[(4-(ジエチルアミノ) ブチル)-N- {4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キナゾリニル) オキシ]-2-ニトロフェニル} ウレア、

N-[3-(ジエチルアミノ) プロピル]-N- {4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キナゾリニル) オキシ]-2-ニトロフェニル} ウレア、

N- {4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キナゾリニル) オキシ]フェニル} -N-(4-メチルピペラジノ) ウレア、および

N- {4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キノリル) オキシ]フェニル} -N-(4-メチルピペラジノ) ウレア。

本発明による化合物の一層好ましい例としては、下記の化合物が挙げられる：

$N - \{4 - [(6, 7\text{-ジメトキシ}-4\text{-キナゾリニル}) \text{オキシ}] - 2\text{-ニトロフェニル}\} - N' - (2\text{-ピペリジノエチル})$ ウレア、および

$N - [2 - (\text{ジエチルアミノ}) \text{エチル}] - N' - \{4 - [(6, 7\text{-ジメトキシ}-4\text{-キナゾリニル}) \text{オキシ}] - 2\text{-ニトロフェニル}\}$ ウレア。

式 (I) の化合物には、鏡像異性配置を形成する 1 またはそれ以上の鏡像異性炭素原子が存在しうる。式 (I) の化合物にはすべての鏡像異性体が含まれる。

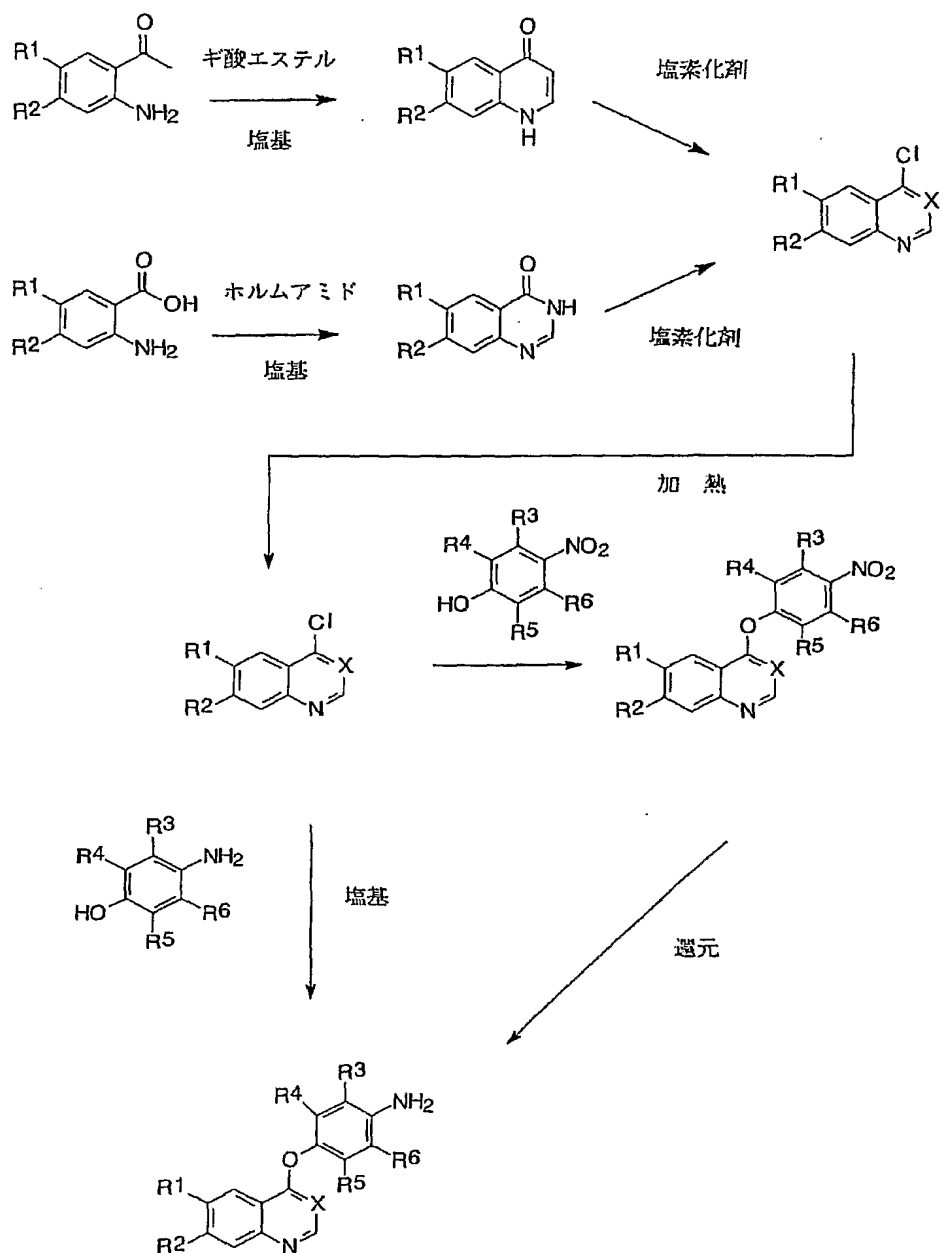
式 (I) の化合物の薬学上許容されうる塩としては、酸付加塩が挙げられる。酸付加塩としては塩酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸、硝酸などの無機酸との塩、またはマレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、シュウ酸、酒石酸、コハク酸、クエン酸、酢酸、乳酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸などの有機酸との塩が挙げられる。

式 (I) の化合物の薬学上許容されうる溶媒和物としては水和物およびエタノール和物が挙げられる。

化合物の製造法

(1) 式 (I) 中、A が基 (i)、(ii)、(xi)、および (x) の化合物は、例えば、スキーム 1 およびスキーム 2 に従って製造できる。

スキーム 1



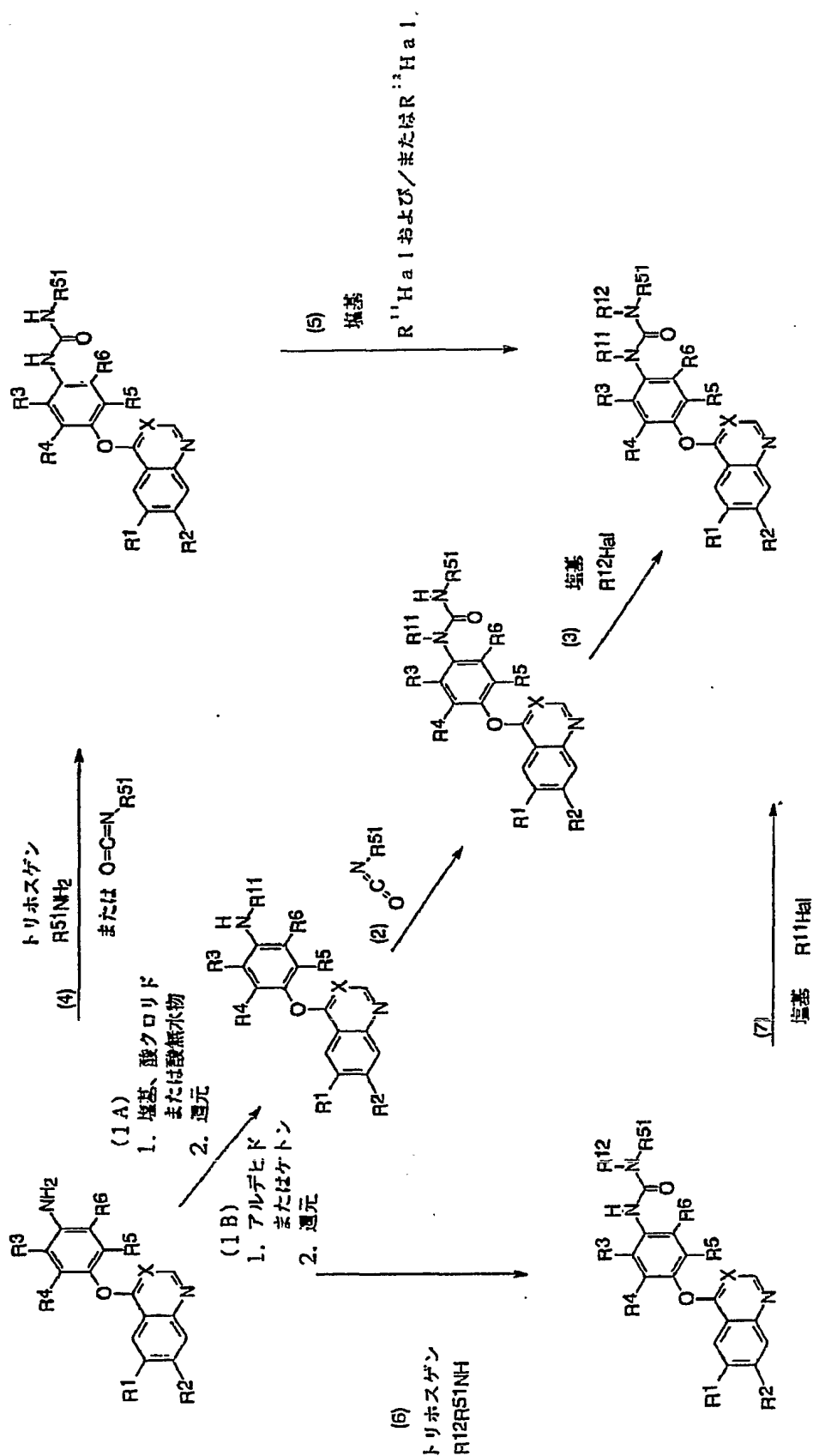
本発明の化合物の合成に必要な出発物質は市販されているか、または常法によって容易に製造できる。

中間体であるキノロン誘導体は、WO 97/17329等に従って合成できる。また、4-クロロキノリン誘導体は、例えば、Org. Synth. Col. Vol.3, 272 (195

5), Acta Chim. Hung., 112, 241 (1983) または WO 98/47873 号に記載の慣用方法によって合成できる。また、4-クロロキナゾリン誘導体は、J. Am. Chem. Soc., 68, 1299 (1946)、J. Am. Chem. Soc., 68, 1305 (1946) や小竹監修、大有機化学、17巻、150頁、朝倉書店 (1967年発行) に記載されるような慣用方法によって合成できる。

4-(ニトロフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体は、適当な溶媒中または無溶媒中においてニトロフェノールに対し4-クロロキノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を作用させることにより合成できる。4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体は、4-(ニトロフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を、適当な溶媒(例えばN,N-ジメチルホルムアミド)中、触媒(例えば水酸化パラジウム-炭素、パラジウム-炭素)存在下、水素雰囲気下において攪拌することにより合成できる。あるいはまた、4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体は、アミノフェノール誘導体に対して、塩基(例えば水素化ナトリウム)の存在下、4-クロロキノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を作用させることにより合成できる。

スキーム2



得られた4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を塩基の存在下、酸クロリドあるいは酸無水物と反応させ、次いで、水素化リチウムアルミニウム等により還元することにより、R¹¹に置換基を導入することができる(工程1A)。

あるいは、得られた4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体をアルデヒドあるいはケトンと反応させ、イミン形成後にシアノ水素化ホウ素ナトリウム等により還元することにより、R¹¹に置換基を導入することもできる(工程1B)。

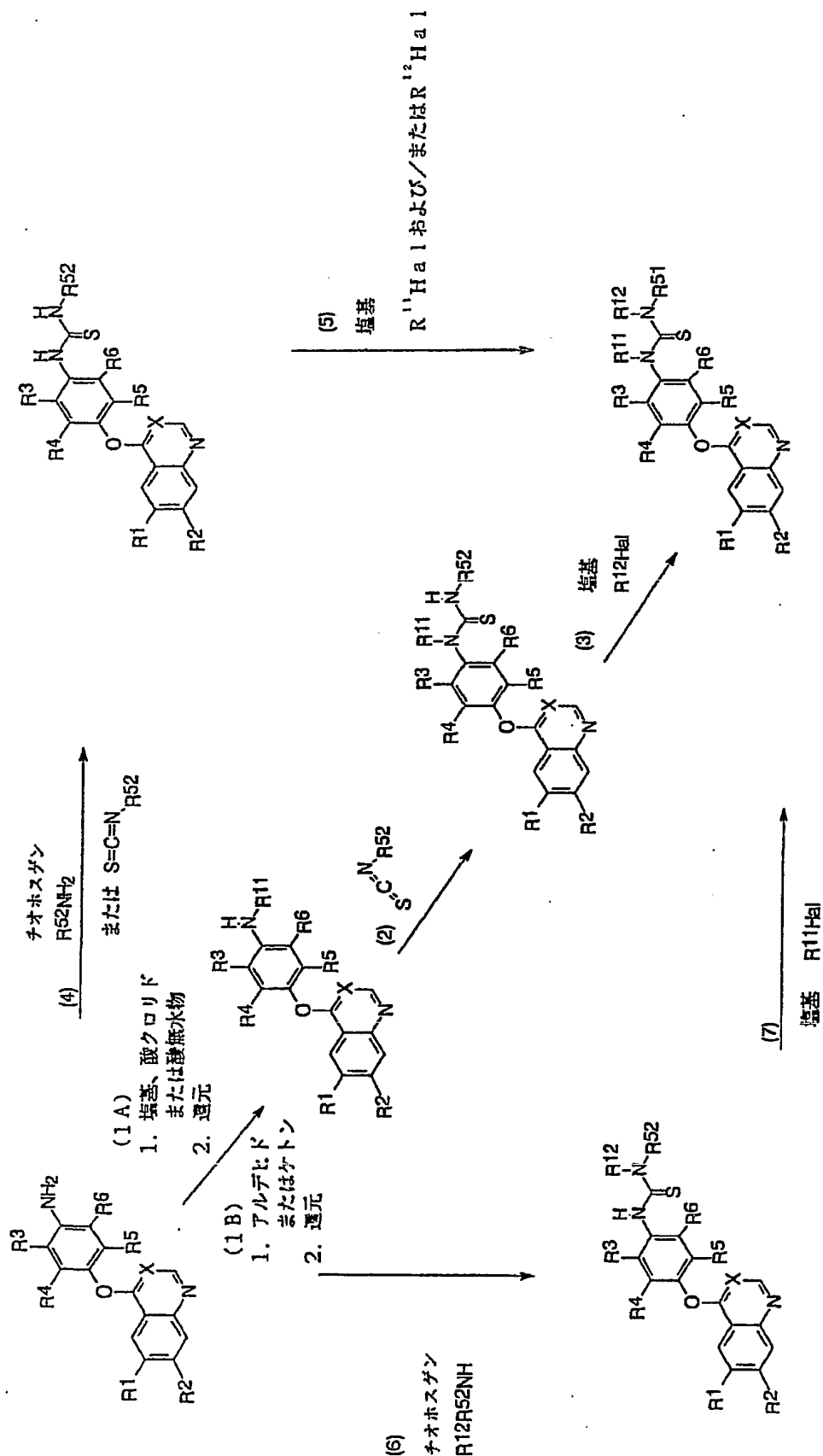
R^{11} に置換基が導入された誘導体を、公知の方法にしたがってイソシアナート誘導体 ($O=C=N-R^{51}$ 、 R^{51} は基 (i) および (ii) からウレア部分を除いた部分を表す) と作用させ (工程2)、必要により塩基 (例えば、水素化ナトリウム) の存在下適当なアルキル化剤 ($R^{12}Hal$) を作用させる (工程3) ことにより式 (I) の化合物を製造できる。

R^{11} および R^{12} は、また、 R^{10} および／または R^{11} が水素原子であるウレア誘導体に塩基 (例えば、水素化ナトリウム) 存在下、適当なアルキル化剤 ($R^{11}Hal$ 、 $R^{12}Hal$) を作用させることによっても導入できる (工程5および7)。

R^{11} および／または R^{12} が水素原子であるウレア誘導体は、スキーム1において得られた4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体に、公知の方法に従ってイソシアナート誘導体を作用させるか、あるいは塩基 (例えば、トリエチルアミン) の存在下トリホスゲン添加後に適当なアルキルアミン ($R^{51}NH_2$ 、 $R^{11}R^{51}NH$) を反応させることにより製造できる (工程4および6)。

(2) 式 (I) 中Aが基 (iii)、(iv)、および(v)の化合物は、例えば、スキーム3に従って製造できる。

スキーム3



得られた4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を塩基の存在下、酸クロリドあるいは酸無水物と反応させ、次いで、水素化リチウムアルミニウム等により還元することにより、R¹¹に置換基を導入することができる(工程1A)。

あるいは、得られた4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体をアルデヒドあるいはケトンと反応させ、イミン形成後にシアノ水素化ホウ素ナトリウム等により還元することにより、R¹¹に置換基を導入することもできる(工程1B)。

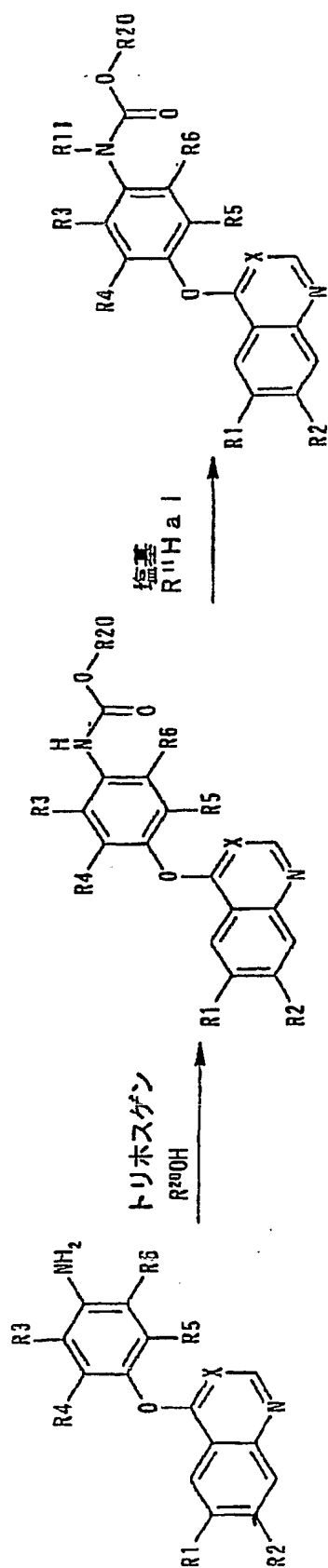
R¹¹に置換基を導入された誘導体が導入された誘導体を、公知の方法にしたがってイソチオシアナート誘導体($S=C=N-R^{52}$ 、R⁵²は基(iii)、(iv)、および(v)からチオウレア部分を除いた部分を表す)と作用させ(工程2)、必要により塩基(例えば、水素化ナトリウム)の存在下適当なアルキル化剤(R¹²H a 1)を作用させる(工程3)ことにより式(I)の化合物を製造できる。

R^{11} および R^{12} は、また、 R^{11} および／または R^{12} が水素原子であるチオウレア誘導体に塩基（例えば、水素化ナトリウム）存在下、適当なアルキル化剤（ $R^{11}H a 1$ 、 $R^{12}H a 1$ ）を作用させることによって導入できる（工程5および7）。

R^{11} および／または R^{12} が水素原子であるチオウレア誘導体は、スキーム1において得られた4-（アミノフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体に、公知の方法に従ってイソチオシアナート誘導体（ $S=C=N-R^{62}$ ）と作用させるか、あるいは塩基（例えば、トリエチルアミン）の存在下チオホスゲン添加後に適当なアルキルアミン（ $R^{52}NH_2$ 、 $R^{11}R^{52}NH$ ）を反応させることにより製造できる（工程4および6）。

（3）式（I）中Aが基（vi）の化合物は、例えば、スキーム4に従って製造できる。

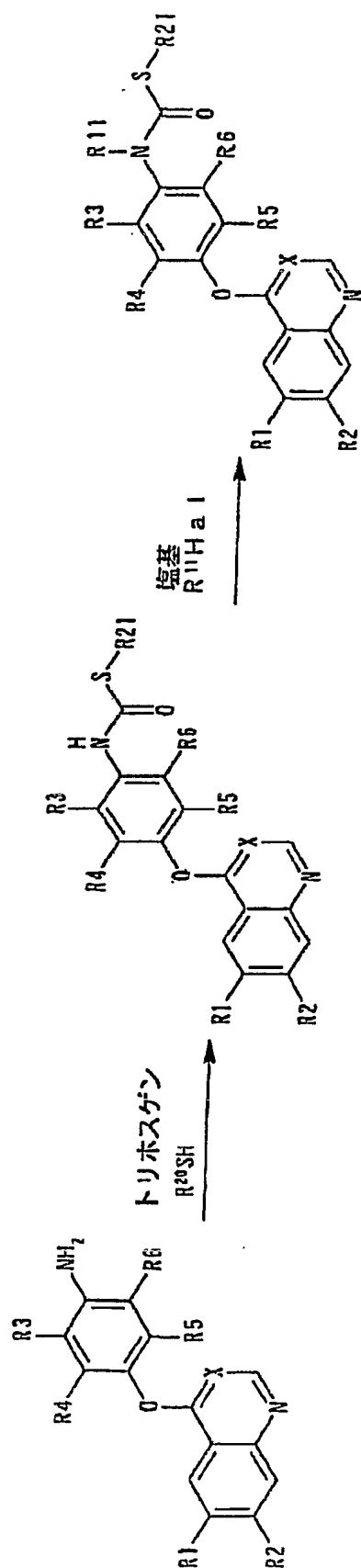
スキーム4



R^{11} および／または R^{12} が水素原子であるウレタン誘導体は、スキーム 1 において得られた 4-（アミノフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体に、公知の方法に従って塩基（例えば、トリエチルアミン）の存在下トリホスゲン添加後に適当なアルコール（ $R^{20}OH$ ）を反応させることにより製造できる。 R^{11} は、 R^{11} が水素原子であるウレタン誘導体に塩基（例えば、水素化ナトリウム）存在下、適当なアルキル化剤（ $R^{11}Hal$ ）を作用させることによって導入できる。

（4）式（I）中Aが基（vii）の化合物は例えば、スキーム 5 に従って製造できる。

スキーム5

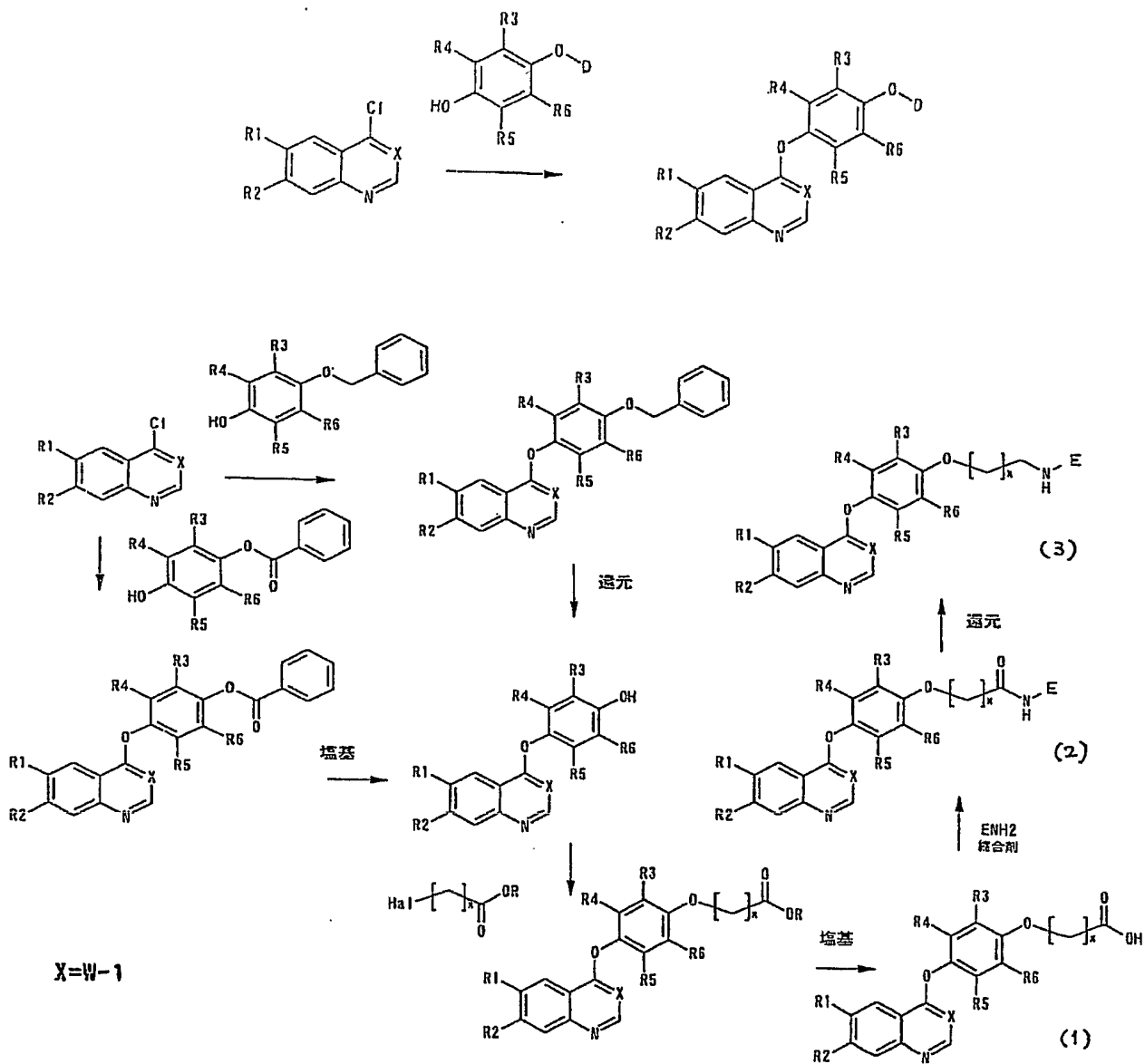


R^{11} および／または R^{12} が水素原子であるチオカルバメート誘導体 ($v=0$) は、スキーム 1 において得られた 4- (アミノフェノキシ) キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体に、公知の方法に従って塩基 (例えば、トリエチルアミン) の存在下トリホスゲン添加後に適当なチオール ($R^{21}SH$) を反応させることにより製造できる。 R^{11} は、 R^{11} が水素原子であるチオカルバメート誘導体に塩基 (例えば、水素化ナトリウム) 存在下、適当なアルキル化剤 ($R^{11}Hal$) を作用させることによって導入できる。

また、酸化誘導体 ($v=1$) は、チオカルバメート誘導体をメタクロロ過安息香酸等の酸化剤を用いて酸化することにより得ることができる。また、酸化誘導体 ($v=2$) は、チオカルバメート誘導体を過マンガン酸カリウムあるいはオキソン等の酸化剤で酸化することにより得られる。

(5) 式(I)中Aが基(viii)および(ix)の化合物は例えば、スキーム6、7、および8に従って製造できる。

L=0の場合 (スキーム 6-1、6-2) :



4-（アルキルオキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体、もしくは4-（アシルオキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体は、適当な溶媒中または無溶媒中において4-アルキルオキシフェノール誘導体もしくは4-アシルオキシフェノール誘導体に対し4-クロロキノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を作用させることによ

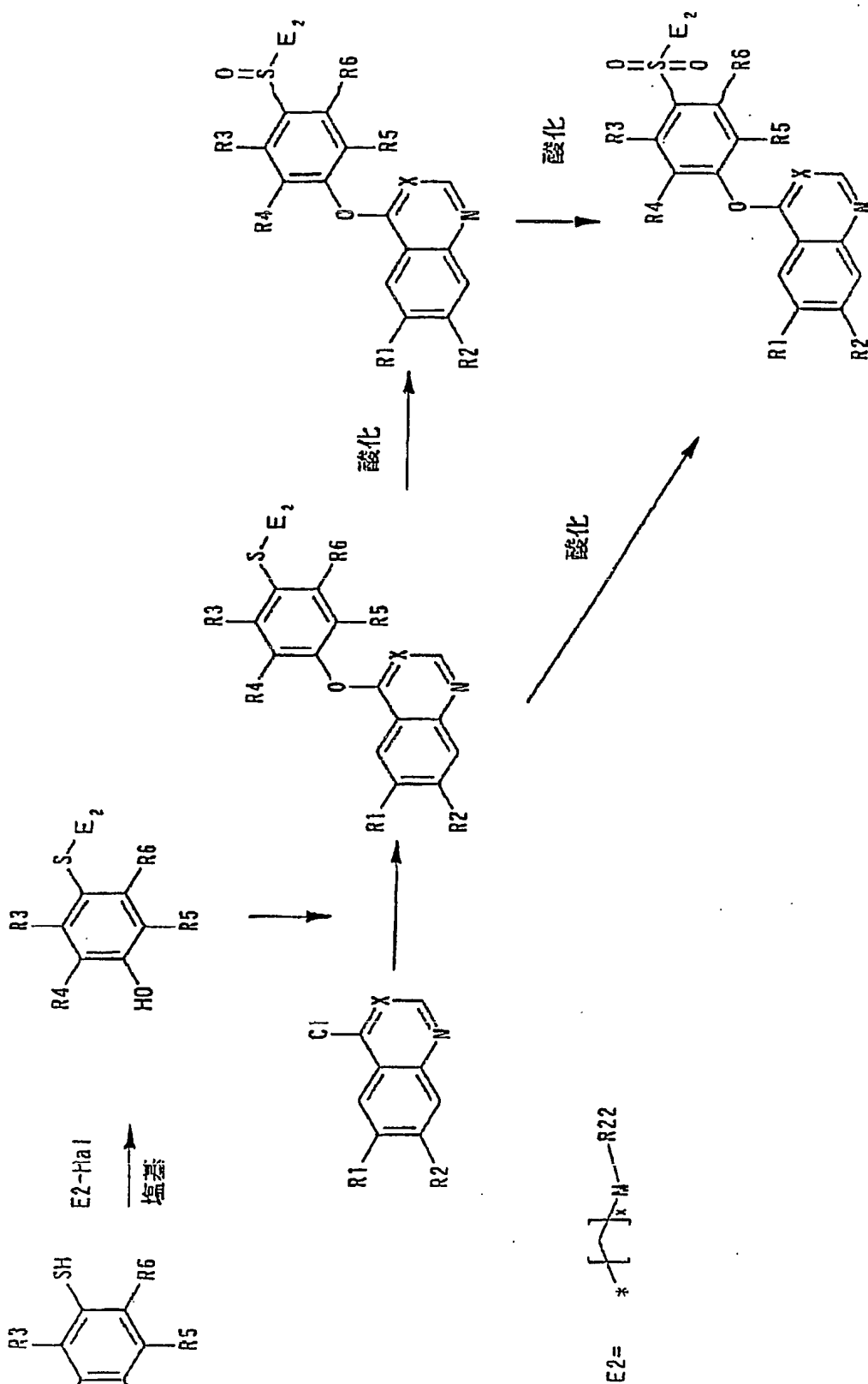
り合成できる（スキーム 6-1）。スキーム中、D は $-(CH_2)_w-M-R^{20}$ を表す。

4-（ベンジルオキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体、あるいは 4-（ベンゾイルオキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体は、適当な溶媒中または無溶媒中において 4-ベンジルオキシフェノール誘導体もしくは 4-ベンゾイルオキシフェノール誘導体に対し 4-クロロキノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を作用させることにより合成できる（スキーム 6-1）。

4-（ヒドロキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体は、4-（ベンジルオキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を、適当な溶媒（例えば、N，N-ジメチルホルムアミド）中、触媒（例えば水酸化パラジウム-炭素、パラジウム-炭素）存在下、水素雰囲気下において脱保護することにより合成できる。4-（ヒドロキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体はまた、4-（ベンゾイルオキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を塩基性条件下（例えば、水酸化ナトリウム）ベンゾイル基を脱保護することによっても合成できる。

4-（ヒドロキシフェノキシ）キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を塩基性条件下（例えば水酸化ナトリウム）、w-ハロゲン化アルキルカルボン酸エステルと反応させ、次いで塩基性（例えば水酸化ナトリウム）条件下エステルを脱保護することによりカルボン酸（1）を得る。このカルボン酸（1）とアミンとを縮合剤（例えば N，N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド）存在下、縮合することによりアミド誘導体（2）を得ることができる。次いで、このアミド誘導体（2）をジボランあるいは水素化リチウムアルミニウム等により還元することにより還元型誘導体（3）を得ることができる（スキーム 6-2）。

L=Sの場合 (スキーム7) :

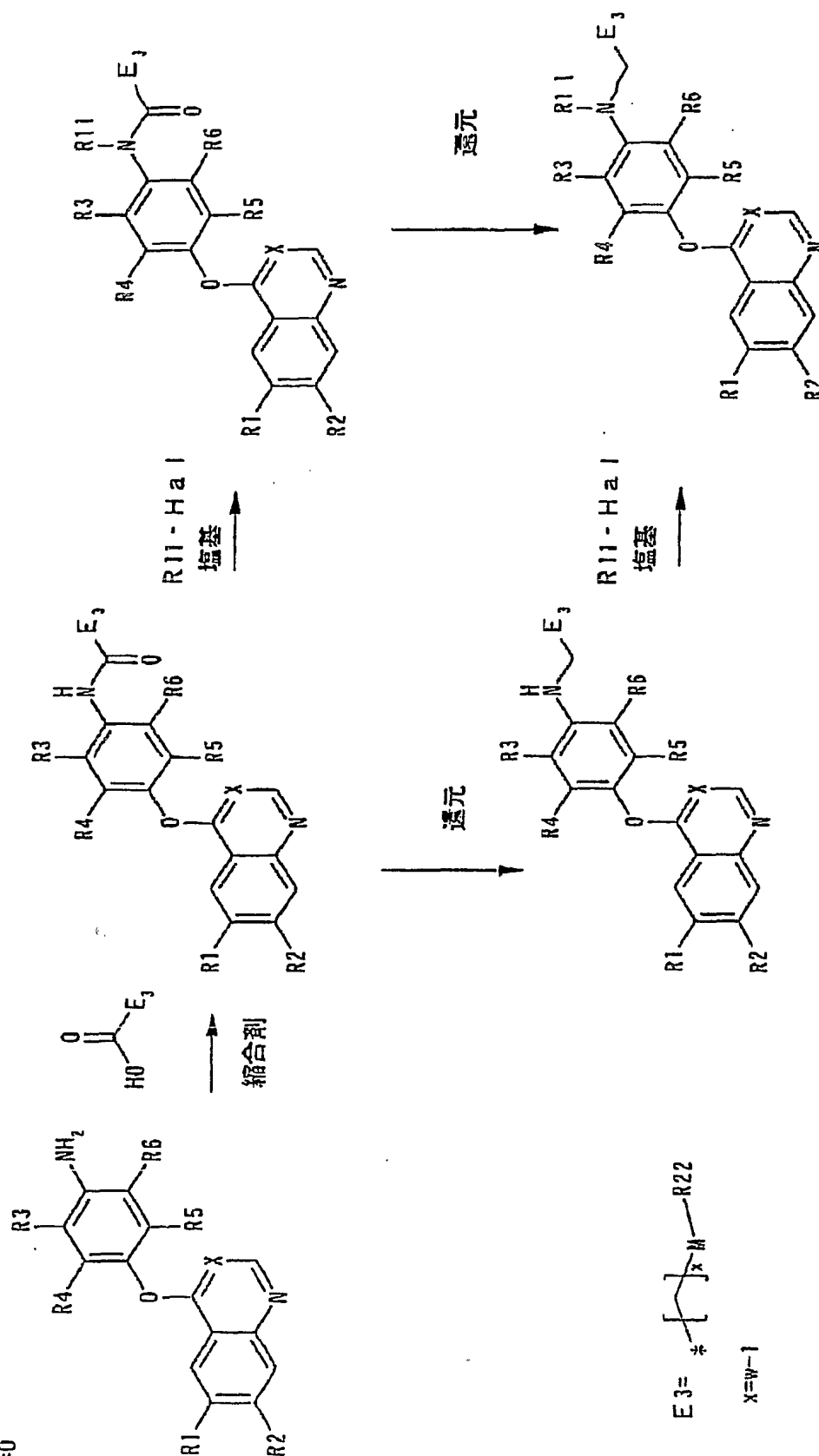


適当な溶媒中または無溶媒中において、4-ヒドロキシチオフェノール誘導体に対し適当なハロゲン化アルキル誘導体を塩基性条件下（例えば炭酸カリウム）反応させることによりS-アルキル置換フェノールを得ることができる。このS-アルキル置換フェノールを4-クロロキノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体を作用させることによりチオ誘導体を合成できる。

また、スルホキシド誘導体は、チオ誘導体をメタクロロ過安息香酸等の酸化剤を用いて酸化することにより得ることができる。また、スルホン誘導体は、チオ誘導体を過マンガン酸カリウムまたはオキシソンの酸化剤で酸化するか、あるいはスルホキシド誘導体を過マンガン酸カリウムまたはオキシソンの酸化剤で酸化することにより得られる。

L=NR¹¹の場合 (スキーム8)

L=NR¹¹-
M=O



差替え用紙 (規則26)

公知の方法により得られる脂肪酸と4-(アミノフェノキシ)キノリン誘導体あるいは相当するキナゾリン誘導体とを縮合剤の存在下アミド化し、得られたアミド誘導体をジボランあるいは水素化リチウムアルミニウム等により還元することにより還元型誘導体を得ることができる。R¹¹は、R¹¹が水素原子である還元型誘導体に塩基（例えば、水素化ナトリウム）存在下、適当なアルキル化剤（R¹¹H a l）を作用させることによって導入できる。あるいは、R¹¹が水素原子であるアミド型誘導体に塩基（例えば、水素化ナトリウム）存在下、適当なアルキル化剤（R¹¹H a l）を作用させることによってR¹¹を導入できる。さらに、ジボランあるいは水素化リチウムアルミニウム等により還元することによりR¹¹に置換基を導入した還元型誘導体を得ることもできる。

化合物の用途

本発明による化合物はインビトロにおいて、PDGF刺激により誘発されるPDGF-R自己リン酸化および血管平滑筋細胞の増殖および遊走を抑制する（薬理試験例1および2参照）。PDGFレセプターの自己リン酸化は、PDGFレセプターの自己リン酸化により媒介される疾患が、血管傷害に起因する血管閉塞または血管狭窄を伴う虚血性疾患、血管の自家移植または同種間移植に起因する血管閉塞または血管狭窄を伴う虚血性疾患、およびPDGFに起因する細胞増殖および臓器線維化を伴う疾患（例えば、慢性関節リウマチや、グリオーマなどPDGF依存性の腫瘍、肝硬変、肺線維症、腎不全患者の透析などに伴う動静脈シャントの閉塞）と関連している（Gordon A. A. Ferns et al., Science, Vol.253, pp1129-1132(1991), Martin G Sirois et al., Circulation, Vol.95, No.3, pp669-675(1997), Marukka Myllarniemi et al., The FASEB Journal, Vol.11, pp1119-1126(1997), H. Ohnishi et al., Life Science, Vol.28, pp1641-1646(1981), J. Gastroenterol. vol. 32, pp496-501(1997), Toxicol. Appl. Pharmacol. vol. 149, pp120-126(1998), Am. J. Pathol. vol. 148, pp785-800(1996)）。また本発明による化合物はVEGF-R阻害活性が低い（薬理試験例5）。VEGF-Rを阻害しない化合物は血管狭窄を亢進しないことが期待できる。更にまた、本発明による化合物は、インビボにおいて、傷害を与えた血管の内膜肥厚を抑制する（薬理試験例4および6）。従って、本発明による化合物は、PDGFレセプターの自己リン酸化により媒介される疾患、特に血管傷害あるいは血管の自家移植や同種間移植に起因する血管閉塞・狭窄を伴う虚血性疾患、の治療に用いることができる。

本発明による化合物は、c-kit自己リン酸化阻害作用が低い。c-kit自己リン酸化阻害作用は、造血や腸管運動において重要な役割を果たしている（実験医学, Vol.11, No.13, pp42-53）。従って、本発明によれば、c-kit自己リン酸化阻害作用に起因する副作用が低い化合物が提供される。

本発明の化合物を有効成分とする医薬組成物は、経口および非経口（例えば、静脈内投与、筋肉内投与、皮下投与、直腸投与、経皮投与）のいずれかの投与経路で、ヒトおよびヒト以外の動物に投与することができる。従って、本発明による化合物を有効成分とする医薬組成物は、投与経路に応じた適当な剤型に処方できる。

具体的には、経口剤としては、錠剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤、シロップ剤などが挙げられ、非経口剤としては、注射剤、坐剤、テープ剤、軟膏剤などが挙げられる。

これらの各種製剤は、通常用いられている賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤、希釈剤などを用いて常法により製造することができる。

賦形剤としては、例えば乳糖、ブドウ糖、コーンスターチ、ソルビット、結晶セルロースが、崩壊剤としては例えばデンプン、アルギン酸ナトリウム、ゼラチン末、炭酸カルシウム、クエン酸カルシウム、デキストリンが、結合剤としては例えばジメチルセルロース、ポリビニルアルコール、ポリビニルエーテル、メチルセルロース、エチルセルロース、アラビアゴム、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドン、カルボキシメチルセルロースナトリウム塩、クレモフォアが、滑沢剤としては、例えばタルク、ステアリン酸マグネシウム、ポリエチレングリコール、硬化植物油がそれぞれ挙げられる。

また、上記注射剤は、必要により緩衝剤、pH調整剤、安定化剤、等張化剤、保存剤を添加して製造することができる。

医薬組成物中の本発明による化合物の含有量は、その剤型に応じて異なるが、通常全組成物中0.5-50重量%、好ましくは、1-20重量%程度である。

投与量は患者の年齢、体重、性別、疾患の相違、症状の程度などを考慮して、個々の場合に応じて適宜決定されるが、例えば0.1~100mg/kg、好ましくは0.1~30mg/kgの範囲であり、これを1日1回または数回に分けて投与することができる。

実施例

本発明を下記例でより詳細に説明するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

製造例1：4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2-ニトロアニリン

ジメチルスルホキシド(15ml)に水素化ナトリウム(60w%、0.20g)を加え室温で10分間攪拌し、4-アミノ-3-ニトロフェノール(0.77g)を加え室温で10分間攪拌した。次に4-クロロ-6,7-ジメトキシキ

ナゾリン (1.12 g) を加え 100°C で 3 時間攪拌した。反応液に水を加えクロロホルムで抽出した後、クロロホルム層を 1 規定水酸化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られた残さにメタノールを加え懸濁液とした。析出した結晶を吸引ろ取し、表題の化合物を 1.10 g、収率 64% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 4.07 (s, 3H), 4.08 (s, 3H), 6.10–6.15 (m, 2H), 6.92 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.35 (dd, $J=9.0$ Hz, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.52 (s, 1H), 8.06 (d, $J=2.9$ Hz, 1H), 8.62 (s, 1H).

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 343 (M^++1)

製造例 2 : 4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キノリル) オキシ] -3-フルオロアニリン

4-クロロ-6, 7-ジメトキシキナゾリン (10.23 g)、2-フルオロ-4-ニトロフェノール (14.37 g) をモノクロロベンゼン (100 ml) に懸濁し、一晩加熱還流した。減圧下溶媒を留去し、残さをトルエンで洗浄、ろ過、乾燥した。次に、結晶を水酸化ナトリウム水溶液に懸濁し、ろ過、乾燥し、4-(3-フルオロ-4-ニトロフェノキシ)-6, 7-ジメトキシキノリンを 14.2 g、収率 90% で得た。4-(2-フルオロ-4-ニトロフェノキシ)-6, 7-ジメトキシキノリン (4.57 g) を酢酸エチル/ N,N -ジメチルホルムアミド/トリエチルアミン (100 ml/100 ml/20 ml) に溶解し、水酸化パラジウム (1.2 g) を加え、水素雰囲気下室温で 1 晩攪拌した。セライトろ過後、減圧下溶媒を留去し、残さに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、表題の化合物を 4.27 g、定量的に得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 3.85 (m, 2H), 4.07 (s, 3H), 4.08 (s, 3H), 6.50–6.60 (m, 3H), 7.02–7.07 (m, 1H), 7.55–7.65 (m, 2H), 8.48 (d, $J=5.6$ Hz, 1H).

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 315 ($M^+ + 1$)

製造例 3 : 3-クロロ-4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キノリル) オキシ]

アニリン

ジメチルスルホキシド (10 ml) に水素化ナトリウム (60 w%, 0.72 g) を加え 50°C で 20 分間攪拌し、4-アミノ-3-クロロフェノール塩酸塩 (1.61 g) を加え室温で 10 分間攪拌した。次に 4-クロロ-6, 7-ジメトキシキノリン (1.00 g) を加え 100°C で一晩攪拌した。反応液に水を加えクロロホルムで抽出した後、クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られた残さにメタノールを加え析出した結晶を吸引ろ取し、表題の化合物を 0.80 g、収率 60% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 4.06 (s, 3H), 4.07 (s, 3H), 6.36 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 6.65 (dd, $J=8.5$ Hz, $J=2.9$ Hz, 1H), 6.76 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 8.46 (d, $J=6.0$ Hz, 1H) .

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 332 ($M^+ + 1$)

製造例 4 : 4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キノリル) オキシ] - 3-メチル

アニリン

4-クロロ-6, 7-ジメトキシキノリン (5.00 g)、4-ニトロ-2-メチルフェノール (6.85 g) をモノクロロベンゼン (25 ml) に懸濁し、一晩加熱還流した。減圧下溶媒を留去し、残さを酢酸エチルで洗浄、ろ過、乾燥した。次に、結晶を水酸化ナトリウム水溶液に懸濁し、ろ過、乾燥し、4-(2-メチル-4-ニトロフェノキシ) - 6, 7-ジメトキシキノリンを 6.89 g 得た。4-(2-メチル-4-ニトロフェノキシ) - 6, 7-ジメトキシキノリン (1.36 g) を酢酸エチル/N, N-ジメチルホルムアミド/トリエチルアミン (25 ml/25 ml/5 ml) に溶解し、水酸化パラジウム (0.4 g) を加え、水素雰囲気下室温で 1 晩攪拌した。セライトろ過後、減圧下溶媒を留去し、残さに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出し、有機層を

無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、表題の化合物を1.31 g、収率91%で得た。

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 311 ($M^+ + 1$)

製造例5 : 4-[(6, 7-ジメトキシ-4-キナゾリニル) オキシ] -2-メトキシアニリン

ジメチルスルホキシド (50 ml) に水素化ナトリウム (60 w%, 3.2 g) を加え50℃で20分間攪拌し、4-アミノ-3-メトキシフェノール (5.6 g) を加え室温で10分間攪拌した。次に4-クロロ-6, 7-ジメトキシキナゾリン (7.0 g) を加え100℃で一晩攪拌した。反応液に水を加えクロロホルムで抽出した後、クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去して得られた残さにメタノールを加え析出した結晶を吸引ろ取し、表題の化合物を7.3 g、収率72%で得た。

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 328 ($M^+ + 1$)

実施例1 : 4-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(129mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (193mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルアルコール(79mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(108 mg, 収率51%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.61(1H, s), 7.16-7.54(10H, m), 6.70(1H, s), 5.16(2H, s), 4.05(6H, s), 2.35(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 446 ($M^+ + 1$)

実施例2：4-メチルベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(109mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (146mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルアルコール(61mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(48mg,収率28%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.61(1H, s) , 8.29(1H, d, $J=9.0$) , 7.50(1H, s) , 7.15-7.35(8H, m) , 5.18(2H, s) , 4.05(3H, s) , 4.05(3H, s) , 2.36(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 481(M^++1)

実施例3：1-(3-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン(72mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (109mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-クロロ- α -メチルベンジルアルコール(46mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg,収率70%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.44-8.50(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.58-7.64(3H, m) , 7.26-7.42(4H, m) , 7.15-7.19(2H, m) , 6.86(1H, s) , 6.67(1H, d, $J=6.6$) , 5.88(1H, q, $J=6.6$) , 4.16。

実施例4：1-(3-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(75mg)をトル

エン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-クロロ- α -メチルベンジルアルコール(50mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(62mg, 収率49%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41-8.47(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.71-7.76(1H, m) , 7.66(1H, s) , 7.25-7.45(4H, m) , 7.01(1H, d, $J=9.2\text{Hz}$) , 6.50-6.55(2H, m) , 5.87(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.10(3H, s) , 1.62(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 508(M^++1)

実施例 5 : 1-(3-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-クロロ- α -メチルベンジルアルコール(50mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(70mg, 収率56%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.37-8.44(1H, m) , 8.07(1H, s) , 7.82(1H, bs) , 7.57(1H, s) , 7.34(1H, s) , 7.20-7.26(3H, m) , 6.88(1H, s) , 6.49(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.44(1H, m) , 5.80(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.10(3H, s) , 4.03(3H, s) , 2.22(3H, s) , 2.04(3H, s) , 1.56(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 508(M^++1)

実施例 6 : 1-(3-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-クロロ- α -メチルベンジルアルコール (50mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(71mg, 収率 57%) 得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.76(1H, s) , 8.07(1H, s) , 7.50-7.60(3H, m) , 7.15-7.39(5H, m) , 6.83(1H, s) , 6.75-6.78(1H, m) , 5.84(1H, q, $J=6.8\text{Hz}$) , 4.16(3H, s) , 4.09(3H, s) , 1.59(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 481 (M^++1)

実施例 7 : 1-(3-クロロフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-クロロ- α -メチルベンジルアルコール (50mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(43mg, 収率 36%) 得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.77(1H, s) , 8.33(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 8.06(1H, s) , 7.55(1H, s) , 7.39(1H, s) , 7.22-7.32(6H, m) , 5.85(1H, q, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.16(3H, s) , 4.09(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 415 (M^++1)

実施例 8 : 4-フルオロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]}フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (108mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-フルオロベンジルアルコール(40mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(68mg, 収率58%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.44-8.50(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.63(1H, s) , 7.56-7.66(2H, m) , 7.38-7.44(2H, m) , 7.16-7.20(2H, m) , 7.05-7.11(2H, m) , 6.85(1H, s) , 6.68(1H, s) , 5.20(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 429(M^++1)

実施例 9 : 4-フルオロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]}-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-フルオロベンジルアルコール (40mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg, 収率62%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.42-8.47(1H, m) , 8.16(1H, s) , 7.66(1H, s) , 6.99-7.45(6H, m) , 6.50-6.56(2H, m) , 5.20(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 477(M^++1)

実施例 10 : 4-フルオロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロベンジルアルコール (40mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg,収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43-8.48(1H,m) , 8.15(1H,m) , 7.91(1H,s) , 7.64(1H,s) , 6.94-7.53(6H,m) , 6.57(1H,d,J=6.6Hz) , 6.49(1H,s) , 5.20(2H,s) , 4.17(3H,s) , 4.11(3H,s) , 2.27(3H,s) , 2.13(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 477(M^++1)

実施例 11 : 4-フルオロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロベンジルアルコール (45mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(43mg,収率33%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.64(1H,s) , 7.56(1H,s) , 7.00-7.54(9H,m) , 6.72(1H,s) , 5.19(2H,s) , 4.09(3H,s) , 4.08(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 450 (M^++1)

実施例 12 : 4-フルオロベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (116mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロベンジルアルコール (45mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(38mg, 収率34%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.64(1H, s) , 8.30(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$) , 7.52(1H, s) , 7.40-7.45(3H, m) , 7.32-7.34(1H, m) , 7.18-7.22(2H, m) , 7.06-7.12(2H, m) , 5.21(2H, s) , 4.08(3H, s) , 4.07(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 485 (M^++1)

実施例 13 : 1-(2-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン(69mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (103mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-クロロ- α -メチルベンジルアルコール(55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg, 収率64%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.40-8.48(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.15-7.64(9H, m) , 6.86(1H, s) , 6.67(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.28(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.16(3H, s) , 4.19(3H, s) , 1.63(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 480 (M^++1)

実施例 14 : 1-(2-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(67mg) をトル

エン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (92mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-クロロ- α -メチルベンジルアルコール (48mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (88mg, 収率79%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.43 (1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 8.14 (1H, s) , 7.72-7.78 (1H, m) , 7.66 (1H, s) , 7.25-7.54 (4H, m) , 7.00 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$) , 6.50-6.57 (2H, m) , 6.27 (1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.17 (3H, s) , 4.11 (3H, s) , 2.27 (3H, s) , 2.09 (3H, s) , 1.63 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 508 (M^++1)

実施例 15 : 1-(2-クロロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (62mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (93mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-クロロ- α -メチルベンジルアルコール (49mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (52mg, 収率48%) 得た。

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 480 (M^++1)

実施例 16 : 1-(2-クロロフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (61mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (91mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-クロロ- α -メチルベンジルアルコール (57mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間

攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg,収率69%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.77(1H, s) , 8.36(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$) , 8.00-8.05(1H, m) , 7.16-7.57(8H, m) , 6.28(1H, q, $J=6.8\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 1.63(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 515(M^++1)

実施例 17 : 3-(2-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (117mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (67mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(80mg,収率58%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43(1H, d, $J=5.4\text{Hz}$) , 7.61(1H, s) , 7.48(1H, s) , 7.35-7.40(1H, m) , 7.18-7.25(2H, m) , 6.87-7.05(3H, m) , 6.43(1H, bs) , 6.27(1H, d, $J=4.9\text{Hz}$) , 4.46(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.05-4.22(2H, m) , 4.07(3H, s) , 4.06(3H, s) , 2.24(3H, s) , 2.11(3H, s) , 2.10-2.22(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 538(M^++1)

実施例 18 : 3-(2-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(71mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (97mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (72mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間

攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(62mg,収率44%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.44(1H, d, $J=5.4\text{Hz}$) , 7.50-7.80(2H, m) , 7.19-7.40(3H, m) , 6.88-6.98(3H, m) , 6.35-6.48(2H, m) , 4.65(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.18(2H, t, $J=6.0\text{Hz}$) , 4.07(3H, s) , 4.07(3H, s) , 2.10-2.30(8H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 538(M^++1)

実施例 19 : 3-(2-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (72mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(62mg,収率44%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.62-8.64(1H, m) , 7.55-7.57(1H, m) , 7.48-7.53(2H, m) , 7.35-7.40(2H, m) , 7.19-7.28(3H, m) , 6.87-6.97(2H, m) , 6.77(1H, bs) , 4.43-4.48(2H, m) , 4.14-4.20(2H, m) , 4.08(3H, s) , 4.07(3H, s) , 2.15-2.28(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 511 (M^++1)

実施例 20 : 3-(2-クロロフェノキシ)プロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (94mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (59mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間

攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg,収率50%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.63(1H, s) , 8.25-8.35(1H, d) , 7.52(1H, s) , 7.14-7.41(6H, m) , 6.88-6.98(2H, m) , 4.48(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.18(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.08(3H, s) , 4.07(3H, s) , 2.10-2.50(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 545(M^++1)

実施例 2 1 : 4-(トリフルオロメチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(112mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (67mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg,収率57%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43-8.48(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.47-7.70(7H, m) , 7.15-7.22(3H, m) , 6.68(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 5.29(2H, s) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 499(M^++1)

実施例 2 2 : 4-(トリフルオロメチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (63mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分

液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(80mg, 収率60%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.44(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 8.00-8.15(1H, m) , 7.53-7.69(6H, m) , 7.03(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 6.54-6.65(1H, m) , 6.47-6.53(1H, m) , 5.29(3H, s) , 4.15(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.11(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 528(M^++1)

実施例 23 : 4-(トリフルオロメチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (63mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(80mg, 収率48%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43-8.48(1H, m) , 8.16(1H, s) , 7.50-7.95(6H, m) , 6.97(1H, s) , 6.55-6.60(2H, m) , 5.29(2H, m) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.29(3H, s) , 2.14(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 528(M^++1)

実施例 24 : 4-(トリフルオロメチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (63mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行な

い、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(60mg, 収率48%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.70(1H, s) , 7.48-7.78(8H, m) , 7.20-7.24(2H, m) , 6.94(1H, bs) , 5.28(2H, s) , 4.13(3H, s) , 4.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 500 (M^++1)

実施例 25 : 4-(トリフルオロメチル)ベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(74mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (99mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(52mg, 収率41%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.62-8.65(1H, m) , 8.25-8.34(1H, m) , 7.16-7.71(9H, m) , 5.27-5.31(2H, m) , 4.05-4.08(6H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 535 (M^++1)

実施例 26 : 3-(2-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (61mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(91mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (57mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg, 収率69%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.43-8.50(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.64(1H, s) , 7.56-7.

6.5(2H,m) , 6.89-7.40(6H,m) , 6.81(1H,s) , 6.68(1H,d,J=6.4Hz) , 4.48(2H,t,J=6.2Hz) , 4.15-4.22(2H,m) , 4.17(3H,s) , 4.10(3H,s) , 2.20-2.30(2H,m)
質量分析値(ESI-MS, m/z) : 510(M⁺+1)

実施例 27 : 3-(4-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (79mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(80mg,収率55%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.44-8.50(1H,m) , 8.15(1H,s) , 7.63(1H,s) , 7.52-7.64(4H,m) , 6.77-6.87(3H,m) , 6.68(1H,d,J=6.3Hz) , 4.41(2H,t,J=6.3Hz) , 4.17(3H,s) , 4.10(3H,s) , 4.05-4.10(2H,m) , 2.15-2.22(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 510(M⁺+1)

実施例 28 : 3-(4-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(84mg,収率60%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.41-8.48(1H,m) , 8.16(1H,s) , 7.65-7.75(1H,m) , 6.82-7.27(7H,m) , 6.43-6.58(1H,m) , 4.41(2H,d,J=6.3Hz) , 4.17(3H,s) , 4.11

(3H,s) , 4.05-4.15(2H,m) , 2.26(3H,s) , 2.10(3H,s) , 2.00-2.08(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 538(M⁺+1)

実施例 29 : 3-(4-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(71mg,収率51%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.43-8.48(1H,m) , 8.15(1H,s) , 7.88(1H,bs) , 7.64(1H,s) , 6.82-7.26(6H,m) , 6.57(1H,d,J=6.6Hz) , 6.43(1H,bs) , 4.12(2H,t,J=6.6Hz) , 4.17(3H,s) , 4.11(3H,s) , 4.05-4.11(2H,m) , 2.28(3H,s) , 2.15-2.23(2H,m) , 2.12(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 538(M⁺+1)

実施例 30 : 3-(4-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(60mg,収率37%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.79(1H,s) , 8.14(1H,s) , 7.61(1H,s) , 7.53-7.58(2H,m) , 7.16-7.26(4H,m) , 6.76-6.86(3H,m) , 4.40(2H,t,J=6.2Hz) , 4.19(3H,s)

, 4.12(3H, s) , 4.02-4.10(2H, m) , 2.15-2.21(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 511 ($M^+ + 1$)

実施例 3 1 : 3-(4-クロロフェノキシ)プロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (121mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(4-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (58mg, 収率 44%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.70(1H, s) , 8.25-8.35(1H, m) , 7.65-7.70(1H, m) , 7.54(1H, s) , 7.15-7.35(4H, m) , 6.82-6.87(3H, m) , 4.42(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.12(3H, s) , 4.09(3H, s) , 4.05-4.13(2H, m) , 2.17-2.25(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 545 ($M^+ + 1$)

実施例 3 2 : 1-(4-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (73mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(110mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (56mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (74mg, 収率 59%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44-8.48(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.63(1H, s) , 7.55-7.62(2H, m) , 7.33-7.38(2H, m) , 7.14-7.18(2H, m) , 6.88-6.94(2H, m) , 6.79(1H, s) , 6.67(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 5.86-5.93(1H, m) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.

82(3H, s) , 1.63(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 476(M⁺+1)

実施例 3 3 : 1-(4-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (94mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (48mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (75mg, 収率 66%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.40-8.45(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.73-7.78(1H, m) , 7.66(1H, s) , 7.33-7.38(2H, m) , 6.98-7.02(1H, m) , 6.89-6.94(2H, m) , 6.53(1H, d, J=6.6Hz) , 6.46(1H, bs) , 5.85-5.92(1H, m) , 4.20(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.82(3H, s) , 2.24(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.63(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 504(M⁺+1)

実施例 3 4 : 1-(4-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (56mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (80mg, 収率 60%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.41-8.47(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.92(1H, s) , 7.64(1H, s) , 6.80-7.40(5H, m) , 6.55(1H, d, J=6.6Hz) , 6.44(1H, s) , 5.85-5.92(1H, m)

, 4.17(3H,s), 4.11(3H,s), 3.82(3H,s), 2.26(3H,s), 2.11(3H,s), 1.64(3H,d,J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 504(M⁺+1)

実施例 35 : 1-(4-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (102mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (52mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg,収率52%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.72(1H,s), 7.85(1H,slike), 7.58(1H,s), 7.48-7.55(2H,m), 7.32-7.37(2H,m), 7.15-7.20(2H,m), 6.87-6.93(2H,m), 6.72(1H,s), 5.85-5.92(1H,m), 4.14(3H,s), 4.10(3H,s), 3.81(3H,s), 1.61(3H,d,J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 477 (M⁺+1)

実施例 36 : 1-(4-メトキシフェニル)エチル-N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(66mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (88mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (45mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(58mg,収率53%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.76(1H,slike), 8.32-8.40(1H,m), 6.88-8.00(9H,m)

, 5.87-5.93(1H,m) , 4.16(3H,s) , 4.10(3H,s) , 3.82(3H,s) , 1.63(3H,d,J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 511(M⁺+1)

実施例 37 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(121mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (74mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(98mg,収率67%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.44-8.50(H,m) , 8.15(1H,s) , 7.64(1H,s) , 7.55-7.64(2H,m) , 7.10-7.31(6H,m) , 6.77(1H,s) , 6.69(1H,d,J=6.6Hz) , 4.32(2H,t,J=6.2Hz) , 4.17(3H,s) , 4.10(3H,s) , 2.97-3.03(2H,m) , 2.33(3H,s) , 1.95-2.05(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 506(M⁺+1)

実施例 38 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (122mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (72mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(93mg,収率62%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.40-8.48(1H,m) , 8.16(1H,s) , 7.65-7.77(2H,m) , 7.

00-7.31(5H,m) , 6.55(1H,d,J=6.4Hz) , 6.40-6.50(1H,m) , 4.29-4.40(1H,m) , 4.17(3H,s) , 4.11(3H,s) , 3.74-3.80(1H,m) , 2.95-3.05(2H,m) , 2.26-2.34(6H,m) , 2.10(3H,s) , 1.84-2.04(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 523(M⁺+1)

実施例 39 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (72mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(82mg, 収率56%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.40-8.49(1H,m) , 8.16(1H,s) , 7.85-7.92(1H,m) , 7.64(1H,s) , 7.08-7.32(4H,m) , 6.95(1H,s) , 6.57(1H,d,J=6.6Hz) , 6.40(1H,s) , 4.30-4.40(2H,m) , 4.17(3H,s) , 4.11(3H,s) , 2.95-3.15(2H,m) , 2.27-2.34(6H,m) , 2.13(3H,s) , 1.98-2.06(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 524(M⁺+1)

実施例 40 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (74mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(82mg, 収率56%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.66(1H, s) , 7.57(1H, s) , 7.48-7.55(2H, m) , 7.10-7.31(7H, m) , 6.65(1H, bs) , 4.27-4.38(2H, m) , 4.10(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.95-3.15(2H, m) , 2.32(3H, s) , 1.95-2.05(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 507 (M^++1)

実施例 4 1 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]プロピルN-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (66mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(68mg, 収率49%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.76(1H, s) , 8.31-8.38(1H, m) , 7.91(1H, bs) , 7.56(2H, s) , 7.10-7.34(6H, m) , 4.30-4.43(2H, m) , 4.16(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.00(2H, t, J=7.0Hz) , 2.32(3H, s) , 1.97-2.06(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 541 (M^++1)

実施例 4 2 : 3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(4-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (73mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(118mg, 収率80%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44-8.48(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.64(1H, s) , 7.57-7.

6.4(2H,m) , 7.15-7.20(2H,m) , 6.83-6.87(5H,m) , 6.65-6.72(1H,m) , 4.17(3H,s) , 4.10(3H,s) , 4.42(2H,t,J=6.2Hz) , 4.06(2H,t,J=6.2Hz) , 3.77(3H,s) , 2.17(2H,t,J=6.2Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 506(M⁺+1)

実施例 4 3 : 3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(88mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (122mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(4-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (74mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(128mg, 収率83%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.42-8.46(1H,m) , 8.16(1H,s) , 7.66-7.75(1H,m) , 7.02(1H,d,J=8.8Hz) , 6.80-6.87(5H,m) , 6.55(1H,d,J=6.6Hz) , 6.46(1H,bs) , 4.41(2H,t,J=6.4Hz) , 4.17(3H,s) , 4.11(3H,s) , 4.04-4.10(2H,m) , 3.77(3H,s) , 2.26(3H,s) , 2.10(3H,s) , 2.14-2.21(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M⁺+1)

実施例 4 4 : 3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(98mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (136mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(4-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (83mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(130mg, 収率76%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.43-8.47(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.89(1H, bs) , 7.64(1H, s) , 6.80-6.97(5H, m) , 6.57(1H, d, J=6.6Hz) , 6.44(1H, s) , 4.42(2H, t, J=6.3Hz) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 4.06(2H, t, J=6.3Hz) , 3.77(3H, s) , 2.28(3H, s) , 2.14-2.24(2H, m) , 2.12(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M⁺+1)

実施例 45 : 3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (122mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(92mg, 収率62%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.66(1H, s) , 7.57(1H, s) , 7.40-7.54(3H, m) , 7.18-7.24(2H, m) , 6.65-6.85(5H, m) , 4.40(2H, t, J=6.3Hz) , 4.09(3H, s) , 4.08(3H, s) , 4.05(2H, t, J=6.1Hz) , 3.77(3H, s) , 2.10-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 507 (M⁺+1)

実施例 46 : 3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(87mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (117mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (72mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(68mg, 収率45%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.68(1H, s) , 8.30(1H, d, J=8.5Hz) , 7.53-7.60(2H, m) , 6.80-7.34(7H, m) , 4.42(2H, t, J=6.4Hz) , 4.11(3H, s) , 4.08(3H, s) , 4.06(2H, t, J=6.2Hz) , 3.77(3H, s) , 2.15-2.22(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 540(M⁺+1)

実施例 47 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(112mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (69mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率69%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.45-8.51(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.63(1H, s) , 7.54-7.64(2H, m) , 7.15-7.23(3H, m) , 6.82(1H, s) , 6.69(1H, d, J=6.6Hz) , 6.45-6.55(3H, m) , 4.42(2H, t, J=6.2Hz) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 4.09(2H, t, J=6.1Hz) , 3.79(3H, s) , 2.15-2.22(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 506(M⁺+1)

実施例 48 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (116mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (72mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(91mg, 収率72%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.43(1H, d, $J=5.4\text{Hz}$) , 7.50-7.63(2H, m) , 6.28-7.24(8H, m) , 4.40(2H, t, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.07(6H, s) , 4.05-4.10(2H, m) , 3.79(3H, s) , 2.24(3H, s) , 2.15-2.23(2H, m) , 2.11(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M^++1)

実施例 49 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (65mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(91mg, 収率72%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.48(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.89(1H, s) , 8.63-8.68(1H, m) , 6.93-7.25(2H, m) , 6.40-6.59(5H, m) , 4.38-4.45(2H, m) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 4.05-4.14(2H, m) , 3.79(3H, s) , 2.15-2.25(2H, m) , 2.28(3H, s) , 2.12(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M^++1)

実施例 50 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(95mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (142mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (87mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(105mg, 収率65%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.69(1H, s) , 7.45-7.97(3H, m) , 7.13-7.21(3H, m) , 6.40-6.80(5H, m) , 4.38(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.10(3H, s) , 4.07(3H, s) , 3.98-4.08(2H, m) , 3.77(3H, s) , 2.08-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 507 (M^++1)

実施例 5 1 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (107mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (67mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(67mg, 収率52%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.70(1H, s) , 8.31(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 7.54(1H, s) , 7.33(1H, d, $J=2.7\text{Hz}$) , 7.15-7.23(3H, m) , 6.47-6.55(4H, m) , 4.43(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.12(3H, s) , 4.09(3H, s) , 4.08-4.13(2H, m) , 3.79(3H, s) , 2.15-2.25(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 541 (M^++1)

実施例 5 2 : 1-(3-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(124mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (64mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率66%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.46(1H, dd, J=6.5Hz) , 8.14(1H, s) , 7.58-7.64(2H, m) , 7.38-7.42(1H, m) , 7.29-7.32(1H, m) , 7.14-7.18(2H, m) , 6.96-7.02(1H, m) , 6.91(1H, d, J=8.3Hz) , 6.86(1H, s) , 6.68(1H, d, J=6.6Hz) , 6.29(1H, q, J=6.5Hz) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.88(3H, s) , 1.58(3H, d, J=6.5Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 476(M⁺+1)

実施例 5 3 : 1-(3-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (123mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (64mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(97mg, 収率70%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.41-8.46(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.77(1H, d, J=8.6Hz) , 7.66(1H, s) , 7.40(1H, d, J=7.8Hz) , 7.30(1H, d, J=7.3Hz) , 6.96-7.20(2H, m) , 6.91(1H, d, J=8.3Hz) , 6.50-6.55(2H, m) , 6.29(1H, q, J=6.5Hz) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.87(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.59(3H, d, J=6.5Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 504(M⁺+1)

実施例 5 4 : 1-(3-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (123mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (64mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することによ

り、表題の化合物を(78mg,収率56%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41-8.48(1H,m) , 8.12(1H,s) , 7.92(1H,s) , 7.62(1H,s) , 7.26-7.42(2H,m) , 6.85-7.00(3H,m) , 6.45-6.58(2H,m) , 6.27(1H,q, J=6.5Hz) , 4.14(3H,s) , 4.08(3H,s) , 3.86(3H,s) , 2.27(3H,s) , 2.08(3H,s) , 1.57(3H,d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 504(M^+ +1)

実施例 5 5 : 1-(3-メトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (124mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (64mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(76mg,収率58%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75(1H,s) , 8.00(1H,bs) , 7.16-7.62(7H,m) , 6.88-7.02(2H,m) , 6.79(1H,bs) , 6.28(1H,q, J=6.4Hz) , 4.16(3H,s) , 4.11(3H,s) , 3.87(3H,s) , 1.58(3H,d, J=6.4Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 477 (M^+ +1)

実施例 5 6 : 1-(3-メトキシフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-メトキシ- α -メチルベンジルアルコール (56mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することによ

り、表題の化合物を(69mg,収率55%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ,400MHz) : 8.80(1H,s) , 8.40(1H,d,J=9.0Hz) , 8.14(1H,s) , 7.14-7.60(5H,m) , 6.97-7.03(1H,m) , 6.91(1H,d,J=8.3Hz) , 6.30(1H,q,J=6.5Hz) , 4.19(3H,s) , 4.12(3H,s) , 3.88(3H,s) , 1.60(3H,d,J=6.5Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 511(M^+ +1)

実施例 57 : 4-(tert-ブチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(137mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ-tert-ブチルベンジルアルコール (75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(109mg,収率69%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ,400MHz) : 8.46(1H,dd,J=6.7Hz) , 8.15(1H,s) , 7.64(1H,s) , 7.59(2H,d,J=9.0Hz) , 7.43(2H,d,J=9.0Hz) , 7.36(2H,d,J=8.3Hz) , 7.18(2H,d,J=9.0Hz) , 6.82(1H,s) , 6.68(1H,d,J=6.7Hz) , 5.21(2H,s) , 4.17(3H,s) , 4.19(3H,s) , 1.34(9H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 488(M^+ +1)

実施例 58 : 4-(tert-ブチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ-tert-ブチルベンジルアルコール (63mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することによ

り、表題の化合物を(101mg,収率72%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.42-8.47(1H, m) , 8.16(1H, s) , 7.75-7.85(1H, m) , 7.67(1H, s) , 7.44(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$) , 7.38(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$) , 7.03(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 6.55(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.52(1H, bs) , 5.21(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.34(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 516(M^++1)

実施例 59 : 4-(tert-ブチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ-tert-ブチルベンジルアルコール (61mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(93mg,収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.47(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.95(1H, bs) , 7.64(1H, s) , 7.36-7.46(4H, m) , 6.95(1H, s) , 6.57(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.50(1H, s) , 5.21(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.26(3H, s) , 2.13(3H, s) , 1.34(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 516 M^++1)

実施例 60 : 4-(tert-ブチル)ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(95mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (144mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ-tert-ブチルベンジルアルコール (79mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を

行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(71mg, 収率42%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.77(1H, s) , 8.07(1H, bs) , 7.61(1H, s) , 7.51-7.58(2H, m) , 7.42(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$) , 7.36(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$) , 7.19(2H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 6.79(1H, s) , 5.20(2H, s) , 4.18(3H, s) , 4.12(3H, s) , 1.33(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 489 (M^++1)

実施例 6 1 : 4-(tert-ブチル)ベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (122mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-メトキシ-tert-ブチルベンジルアルコール (67mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(55mg, 収率36%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.80(1H, s) , 8.41(1H, d, $J=9.2\text{Hz}$) , 8.13(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.36-7.46(4H, m) , 7.24-7.34(2H, m) , 7.17-7.22(1H, m) , 5.22(2H, s) , 4.19(3H, s) , 4.12(3H, s) , 1.34(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 523 (M^++1)

実施例 6 2 : 3,4-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (65mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(100mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,4-ジメトキシベンジルアルコール (55mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を

(70mg, 収率60%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.49(1H, s) , 8.14(1H, s) , 7.58-7.64(3H, m) , 7.17-7.22(2H, m) , 6.86-7.04(4H, m) , 6.69(1H, m) , 5.17(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.92(3H, s) , 3.90(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492($\text{M}^+ + 1$)

実施例 6 3 : 3,4-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(65mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (107mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,4-ジメトキシベンジルアルコール (60mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (73mg, 収率55%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.46(1H, dd, $J=6.6\text{Hz}$) , 8.15(1H, s) , 7.75-7.80(1H, m) , 7.66(1H, s) , 6.83-7.05(4H, m) , 6.55(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.51(1H, s) , 5.17(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.12(3H, s) , 3.92(3H, s) , 3.91(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 520($\text{M}^+ + 1$)

実施例 6 4 : 3,4-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(89mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (124mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,4-ジメトキシベンジルアルコール (72mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (102mg, 収率67%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.44-8.50(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.91(1H, s) , 7.62(1H, s) , 6.80-7.03(4H, m) , 6.55(1H, d, J=6.3Hz) , 6.48(1H, s) , 5.15(2H, s) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.90(3H, s) , 3.88(3H, s) , 2.24(3H, s) , 2.11(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 519(M⁺+1)

実施例 6 5 : 3,4-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (147mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,4-ジメトキシベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (70mg, 収率 48%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.79(1H, s) , 8.14(1H, s) , 7.54-7.64(3H, m) , 7.18-7.24(2H, m) , 6.79-7.01(4H, m) , 5.16(2H, s) , 4.19(3H, s) , 4.12(3H, s) , 3.92(3H, s) , 3.90(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M⁺+1)

実施例 6 6 : 3,4-ジメトキシベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,4-ジメトキシベンジルアルコール (58mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (53mg, 収率 42%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.68(1H, s) , 8.33(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$) , 7.50-7.60(2H, m) , 6.83-7.35(6H, m) , 5.18(2H, s) , 4.11(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.93(3H, s) , 3.90(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 527(M^++1)

実施例 67 : 2,5-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3,5-ジメトキシベンジルアルコール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (90mg, 収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.47(1H, dlike, $J=6.6\text{Hz}$) , 8.14(1H, s) , 6.67-7.66(10H, m) , 5.27(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.84(3H, s) , 3.79(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 491(M^++1)

実施例 68 : 2,5-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3,5-ジメトキシベンジルアルコール (80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (92mg, 収率60%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 8.05(1H, s) , 7.74-7.80(1H, m) , 7.66(1H, s) , 6.78-7.40(4H, m) , 6.50-6.58(2H, m) , 5.27(2H, s) , 4.16(3H,

s), 4.11(3H,s), 3.85(3H,s), 3.79(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 520(M⁺+1)

実施例 69 : 2,5-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフエニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,5-ジメトキシベンジルアルコール (73mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (92mg, 収率 60%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.46(1H, d like, J=6.6Hz), 8.15(1H, s), 7.95(1H, s), 7.65(1H, s), 6.85-7.02(4H, m), 6.58(1H, d, J=6.6Hz), 6.53(2H, s), 5.28(2H, s), 4.17(3H, s), 4.11(3H, s), 3.85(3H, s), 3.80(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 519M⁺+1)

実施例 70 : 2,5-ジメトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,5-ジメトキシベンジルアルコール (65mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (66mg, 収率 52%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.80(1H, s), 8.14(1H, s), 7.55-7.63(3H, m), 7.16-7.22(2H, m), 6.83-7.00(3H, m), 5.26(2H, s), 4.19(3H, s), 4.12(3H, s), 3.83(3H, s), 3.79(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492($M^+ + 1$)

実施例 7 1 : 2,5-ジメトキシベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3,5-ジメトキシベンジルアルコール (60mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (59mg, 収率 46%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75 (1H, s) , 8.39 (1H, d, $J=9.3\text{Hz}$) , 6.73-7.85 (8H, m) , 5.28 (2H, s) , 4.15 (3H, s) , 4.10 (3H, s) , 3.84 (3H, s) , 3.80 (3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 527($M^+ + 1$)

実施例 7 2 : 3-{[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル-1-プロパノール(80mg)を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (81mg, 収率 57%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.45-8.50 (1H, m) , 8.14 (1H, s) , 7.64 (1H, s) , 7.58-7.66 (2H, m) , 7.16-7.33 (6H, m) , 6.80 (1H, s) , 6.69 (1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.33 (2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.17 (3H, s) , 4.10 (3H, s) , 3.01 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$) , 1.99-2.07 (2H, m) , 1.31 (9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 548($M^+ + 1$)

実施例 7 3 : 3-{[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (121mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(109mg, 収率74%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.44(1H, d, J=5.4Hz) , 7.48-7.64(3H, m) , 7.27-7.35(4H, m) , 6.97-7.03(1H, m) , 6.38(1H, bs) , 6.28(1H, d, J=5.4Hz) , 4.31(2H, t, J=6.2Hz) , 4.07(3H, s) , 2.98-3.13(2H, m) , 2.25(3H, s) , 2.12(3H, s) , 1.98-2.06(2H, m) , 1.30(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 576(M⁺+1)

実施例 7 4 : 3-{[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (122mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(113mg, 収率73%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.45-8.50(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.89(1H, s) , 7.65(1H, s) , 7.32(4H, s) , 6.95(1H, s) , 6.58(1H, d, J=6.4Hz) , 6.44(1H, s) , 4.33(2H, t, J=6.4Hz) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.02(2H, t, J=7.1Hz) , 2.29(3H, s) , 2.13(3H, s) , 2.00-2.08(2H, m) , 1.31(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 576($M^+ + 1$)

実施例 7 5 : 3-{[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(100mg, 収率 64%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.73(1H, s like), 8.52-8.60(1H, m) , 7.70-7.90(2H, m) , 6.80-7.65(8H, m) , 4.29-4.33(2H, m) , 4.10-4.16(6H, m) , 2.98-3.04(2H, m) , 1.90-2.10(2H, m) , 1.31(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 549($M^+ + 1$)

実施例 7 6 : 3-{[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル}プロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-(tert-ブチル)フェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(68mg, 収率 47%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.80(1H, s) , 8.33-8.38(1H, m) , 8.07(1H, bs) , 7.15-7.62(8H, m) , 4.35(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.18(3H, s) , 4.12(3H, s) , 3.02(2H, t, $J=7.1\text{Hz}$) , 2.00-2.08(2H, m) , 1.31(9H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 583($M^+ + 1$)

実施例 77 : 3-[(4-クロロ-2-メチルフェニル)スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (73mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-[4-クロロ-2-メチルフェニル]スルファニル-1-プロパノール(80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(98mg, 収率69%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.45-8.50(1H, m) , 8.15(1H, s) , 7.57-7.65(3H, m) , 7.12-7.25(5H, m) , 6.82(1H, s) , 6.69(1H, d, J=6.6Hz) , 4.33(2H, t, J=6.2Hz) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 2.99(2H, t, J=7.2Hz) , 2.37(3H, s) , 1.95-2.08(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 540(M⁺+1)

実施例 78 : 3-[(4-クロロ-2-メチルフェニル)スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-[4-クロロ-2-メチルフェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率58%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.43-8.50(1H, m) , 8.16(1H, s) , 7.66-7.76(2H, m) , 7.00-7.25(5H, m) , 6.55(1H, d, J=6.6Hz) , 6.46(1H, s) , 4.33(2H, t, J=6.2Hz) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.96-3.03(2H, m) , 2.37(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.11(3H, s) , 1.98-2.10(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 468(M⁺+1)

実施例 79 : 3-[(4-クロロ-2-メチルフェニル)スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-クロロ-2-メチルフェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(81mg, 収率49%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.42-8.48(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.86(1H, s) , 7.62(1H, s) , 7.08-7.23(3H, m) , 6.94(1H, s) , 6.56(1H, d, J=6.6Hz) , 6.43(1H, s) , 4.31(2H, t, J=6.2Hz) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.97(2H, t, J=7.2Hz) , 2.35(3H, s) , 2.26(3H, s) , 2.11(3H, s) , 1.96-2.06(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 568(M⁺+1)

実施例 80 : 3-[(4-クロロ-2-メチルフェニル)スルファニル}プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(88mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-クロロ-2-メチルフェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg, 収率45%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.73(1H, s) , 7.85(1H, bs) , 7.60(1H, s) , 7.51-7.57(2H, m) , 7.10-7.24(5H, m) , 6.74(5H, m) , 4.32(2H, t, J=6.1Hz) , 4.15(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.98(2H, t, J=7.2Hz) , 2.37(3H, s) , 1.98-2.07(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 541(M^++1)

実施例 8 1 : 3-[(4-クロロ-2-メチルフェニル)スルファニル]プロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-[4-クロロ-2-メチルフェニル]スルファニル-1-プロパノール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(69mg, 収率50%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.66(1H, s) , 8.23-8.33(1H, m) , 7.53(1H, s) , 7.46(1H, s) , 7.34(1H, d, $J=2.7\text{Hz}$) , 7.12-7.25(5H, m) , 4.34(2H, t, $J=7.1\text{Hz}$) , 4.09(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.00(2H, t, $J=7.1\text{Hz}$) , 2.37(3H, s) , 2.00-2.08(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 575(M^++1)

実施例 8 2 : 3-(トリフルオロメチル)フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、 3-トリフルオロメチルフェネチルアルコール(70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(101mg, 収率76%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.42-8.49(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.61(1H, s) , 7.42-7.59(6H, m) , 7.13-7.18(2H, m) , 6.76(1H, s) , 6.66(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.44(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.07(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 513(M^++1)

実施例 8 3 : 3-(トリフルオロメチル)フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチルフェネチルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率73%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.4-8.49(1H, m) , 8.16(1H, s) , 7.67(1H, s) , 7.40-7.56(5H, m) , 7.02(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$) , 6.54(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.42(1H, bs) , 4.46(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.09(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 2.23(3H, s) , 2.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 541(M^++1)

実施例 8 4 : 3-(トリフルオロメチル)フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチルフェネチルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(79mg, 収率56%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.13-8.62(2H, m) , 7.26-8.00(6H, m) , 6.96(1H, s) , 6.64-6.28(1H, m) , 6.42(1H, bs) , 4.46(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.03-4.18(6H, m) , 3.07-3.13(3H, m) , 2.23-2.30(3H, m) , 2.11(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 541(M^++1)

実施例 85 : 3-(トリフルオロメチル)フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチルフェネチルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(68mg, 収率45%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.76(1H, s) , 8.01(1H, s) , 7.60(1H, s) , 7.43-7.58(6H, m) , 7.17-7.24(2H, m) , 6.79(1H, s) , 4.44(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.08(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 514(M^++1)

実施例 86 : 3-(トリフルオロメチル)フェネチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチルフェネチルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(69mg, 収率46%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.79(1H, s) , 8.27-8.34(1H, m) , 8.03(1H, s) , 7.30-7.62(6H, m) , 7.24-7.23(2H, m) , 4.46(2H, t, $J=6.8\text{Hz}$) , 4.18(3H, s) , 4.11(3H, s) , 3.10(2H, t, $J=6.9\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 549(M^++1)

実施例 87 : 1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメト

キシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (74mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(115mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチル- α -メチルベンジルアルコール(70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(81mg, 収率59%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41-8.48(1H, m) , 8.11(1H, s) , 7.45-7.68(7H, m) , 7.13-7.18(2H, m) , 6.93(1H, s) , 6.65(1H, d, J=6.6Hz) , 5.94(1H, q, J=6.6Hz) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 1.63(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 513(M^+ +1)

実施例 88 : 1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチル- α -メチルベンジルアルコール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(90mg, 収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.39-8.45(1H, m) , 8.13(1H, s) , 7.40-7.72(6H, m) , 6.99(1H, d, J=9.0Hz) , 6.48-6.55(2H, m) , 5.93(1H, t, J=6.6Hz) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.24(3H, s) , 2.07(3H, s) , 1.63(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 542(M^+ +1)

実施例 89 : 1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチル- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg, 収率58%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.47(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.84(1H, s) , 7.45-7.68(5H, m) , 6.93(1H, s) , 6.47-6.57(2H, m) , 5.93(1H, q, $J=6.8\text{Hz}$) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.63(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 542(M^++1)

実施例 90 : 1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(89mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチル- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(80mg, 収率48%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75(1H, s) , 8.07(1H, s) , 7.14-7.63(8H, m) , 6.95(1H, s) , 6.79(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$) , 5.93(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 514(M^++1)

実施例 91 : 1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(76mg) をトル

エン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-トリフルオロメチル- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (53mg, 収率39%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.76(1H, s) , 7.86(1H, s) , 7.20-7.65(6H, m) , 6.88-6.92(2H, m) , 6.72-6.77(1H, m) , 5.87-5.95(1H, m) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 1.60(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 549 (M^++1)

実施例 9 2 : 1-(2,4,5-トリフルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (87mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (130mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2,4,5-トリフルオロ- α -メチルベンジルアルコール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (77mg, 収率49%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41-8.49(1H, m) , 8.11(1H, s) , 7.56-7.64(4H, m) , 7.12-7.20(2H, m) , 6.80-6.72(2H, m) , 6.65(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.07(1H, q, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 1.59(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 499 (M^++1)

実施例 9 3 : 1-(2,4,5-トリフルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレ

ンに溶解したトリホスゲン (130mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2, 4, 5-トリフルオロ- α -メチルベンジルアルコール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (61mg, 収率 46%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.47 (1H, m) , 8.13 (1H, s) , 7.62-7.74 (2H, m) , 6.82-6.72 (3H, m) , 6.48-6.55 (2H, m) , 6.07 (1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.15 (3H, s) , 4.09 (3H, s) , 2.26 (3H, s) , 2.08 (3H, s) , 1.59 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 528 (M^++1)

実施例 9 4 : 1-(2,4,5-トリフルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (130mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2, 4, 5-トリフルオロ- α -メチルベンジルアルコール (80mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (68mg, 収率 48%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.48-8.48 (1H, m) , 8.11 (1H, s) , 7.84 (1H, s) , 7.61 (1H, s) , 6.80-7.30 (3H, m) , 6.52-6.57 (2H, m) , 6.06 (1H, q, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.14 (3H, s) , 4.08 (3H, s) , 2.28 (3H, s) , 2.09 (3H, s) , 1.59 (3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 527 (M^++1)

実施例 9 5 : 1-(2,4,5-トリフルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (89mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (130mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2, 4, 5-トリ

フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg,収率32%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.73(1H, s) , 8.05(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.53-7.58(1H, m) , 6.50-7.25(6H, m) , 6.00-6.10(1H, m) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 1.57(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 500(M^++1)

実施例 9 6 : 1-(2,4,5-トリフルオロフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (130mg) を加えて 15分間加熱還流した。続いて、2,4,5-トリフルオロ- α -メチルベンジルアルコール (80mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(48mg,収率35%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.72(1H, s) , 8.27(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 7.99(1H, s) , 7.50(1H, s) , 6.80-7.28(5H, m) , 5.95-6.08(1H, m) , 4.11(3H, s) , 4.04(3H, s) , 1.56(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 535(M^++1)

実施例 9 7 : 1-(3-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (97mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(150mg) を加えて 15分間加熱還流した。続いて、 3-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール(70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反

応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(111mg, 収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41-8.47(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.55-7.62(3H, m) , 6.86-7.38(7H, m) , 6.65(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 5.88(1H, t, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 1.60(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 463(M^++1)

実施例 98 : 1-(3-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(86mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (150mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(89mg, 収率64%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.38-8.44(1H, m) , 8.13(1H, s) , 7.66-7.75(1H, m) , 7.64(1H, s) , 6.95-7.36(6H, m) , 6.51(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 5.87(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.07(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M^++1)

実施例 99 : 1-(3-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(97mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (150mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて

分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(108mg,収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.40-8.45(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.87(1H, s) , 7.62(1H, s) , 6.90-7.38(5H, m) , 6.54(1H, d, $J=6.8\text{Hz}$) , 6.49(1H, s) 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M^++1)

実施例 100 : 1-(3-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(99mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (150mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(60mg,収率36%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.75(1H, s) , 7.98(1H, bs) , 8.47(1H, bs) , 6.48-7.60(9H, m) , 5.82-5.90(1H, m) , 4.13(3H, s) , 4.08(3H, s) , 1.58(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 464(M^++1)

実施例 101 : 1-(3-フルオロフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(98mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (10ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (150mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することによ

り、表題の化合物を(49mg,収率31%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.78(1H, s) , 8.34(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$) , 8.13(1H, s) , 7.56(1H, s) , 6.97-7.38(7H, m) , 5.88(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 499(M^++1)

実施例 102 : 1-(4-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール(57mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(91mg,収率73%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.43-8.48(1H, m) , 8.14(1H, s) , 7.63(1H, s) , 7.57-7.61(2H, m) , 7.37-7.42(2H, m) , 7.14-7.19(2H, m) , 7.04-7.10(2H, m) , 6.86(1H, s) , 6.66(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 5.90(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 1.62(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 461(M^++1)

実施例 103 : 1-(4-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(86mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (117mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することによ

り、表題の化合物を(94mg,収率72%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.42-8.48(1H,m) , 8.15(1H,s) , 7.74(1H,d,J=8.5Hz) , 7.66(1H,s) , 7.37-7.43(2H,m) , 6.98-7.10(3H,m) , 6.48-6.55(2H,m) , 5.90(1H,q,J=6.6Hz) , 4.17(3H,s) , 4.10(3H,s) , 2.25(3H,s) , 2.09(3H,s) , 1.63(3H,d,J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M^++1)

実施例 104 : 1-(4-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (123mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (58mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(87mg,収率64%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.48(1H,m) , 8.12(1H,s) , 7.88(1H,s) , 7.61(1H,s) , 7.30-7.41(2H,m) , 7.30-7.41(2H,m) , 7.00-7.10(2H,m) , 6.91(1H,s) , 6.53(1H,d,J=6.6Hz) , 6.45(1H,s) , 5.87(1H,q,J=6.7Hz) , 4.14(3H,s) , 4.08(3H,s) , 2.25(3H,s) , 2.09(3H,s) , 1.61(3H,d,J=6.7Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M^++1)

実施例 105 : 1-(4-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (57mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行な

い、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(59mg,収率47%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.77(1H, s) , 8.08(1H, s) , 7.60(1H, s) , 7.52-7.58(2H, m) , 7.36-7.41(2H, m) , 7.16-7.20(2H, m) , 7.02-7.09(2H, m) , 6.79(1H, s) , 5.89(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.18(3H, s) , 4.11(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 464(M^++1)

実施例 106 : 1-(4-フルオロフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (114mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (54mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(45mg,収率35%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.80(1H, s) , 8.35(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 8.12(1H, s) , 7.57(1H, s) , 7.05-7.44(7H, m) , 5.90(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.19(3H, s) , 4.11(3H, s) , 1.63(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 499(M^++1)

実施例 107 : 4-メチルベンジル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(140mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルメルカプタン(60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(90mg,

収率65%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43-8.50(1H, m) , 8.13(1H, s) , 7.55-7.72(4H, m) , 7.00-7.26(6H, m) , 6.67(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.21(2H, s) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 2.33(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 462(M^++1)

実施例 108 : 4-メチルベンジル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (145mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルメルカプタン (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(87mg, 収率60%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.47(1H, bs) , 8.16(1H, s) , 7.58-7.70(2H, m) , 6.88-7.26(6H, m) , 6.6(1H, bs) , 4.21(2H, s) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.34(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.14(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 490(M^++1)

実施例 109 : 4-メチルベンジル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (145mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルメルカプタン (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(74mg, 収率54%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.45-8.52(1H,m) , 8.15(1H,s) , 7.80(1H,s) , 7.64(1H,s) , 6.89-7.28(6H,m) , 6.57(1H,d,J=6,3Hz) , 4.22(2H,s) , 4.17(3H,s) , 4.11(3H,s) , 2.34(3H,s) , 2.28(3H,s) , 2.13(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 490(M^++1)

実施例 1 1 0 : 4-メチルベンジル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(81mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルメルカプタン (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(74mg, 収率54%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.72(1H,s) , 8.12(1H,s) , 7.50-7.67(4H,m) , 7.10-7.26(6H,m) , 4.21(2H,s) , 4.18(3H,s) , 4.12(3H,s) , 2.33(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 462(M^++1)

実施例 1 1 1 : 4-メチルベンジル {2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン}メタンチオエート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチルベンジルメルカプタン (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(58mg, 収率42%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.81(1H,s) , 8.44(1H,d,J=9.3Hz) , 8.13(1H,s) , 7.52-7.55(2H,m) , 7.11-7.34(6H,m) , 4.24(2H,s) , 4.19(3H,s) , 4.12(3H,s) , 2.

34(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 497(M⁺+1)

実施例 1 1 2 : 1-(2-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (88mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(145mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール(90mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(89mg, 収率54%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.44(1H, d, J=6.7Hz) , 8.12(1H, s) , 6.90-7.61(10H, m) , 6.65(1H, d, J=6.7Hz) , 6.20(1H, q, J=6.4Hz) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 1.59(3H, d, J=6.4Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 524(M⁺+1)

実施例 1 1 3 : 1-(2-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (145mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール (90mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(101mg, 収率71%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.43(1H, dd, J=6.5Hz) , 8.15(1H, s) , 7.15-7.78(6H, m) , 7.00(1H, d, J=8.8Hz) , 6.57(1H, bs) , 6.52(1H, d, J=6.5Hz) , 6.21(1H, q, J=6.5 Hz) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 2.28(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.62(3H, d, J=6.

5Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 552($M^+ + 1$)

実施例 1 1 4 : 1-(2-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (148mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール (90mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (70mg, 収率 45%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.45(1H, dd, $J=6.6\text{Hz}$) , 8.14(1H, s) , 7.92(1H, bs) , 7.15-7.65(6H, m) , 6.94(1H, s) , 6.46-6.58(2H, m) , 6.22(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 2.30(3H, s) , 2.10(3H, s) , 1.63(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 552($M^+ + 1$)

実施例 1 1 5 : 1-(2-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール (90mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (60mg, 収率 35%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75(1H, s) , 8.04(1H, s) , 7.14-7.61(9H, m) , 6.94(1H, bs) , 6.20(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 1.60(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 525($M^+ + 1$)

実施例 1 1 6 : 1-(2-ブロモフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(85mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (139mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール (90mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg, 収率33%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.80(1H, s) , 8.38(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$) , 8.14(1H, s) , 7.16-7.60(7H, m) , 6.23(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.19(3H, s) , 4.11(3H, s) , 1.63(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 560(M^++1)

実施例 1 1 7 : 1-(3-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (72mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(111mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール(75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(79mg, 収率584%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.46(1H, dd, $J=6.4\text{Hz}$) , 8.13(1H, s) , 7.16-7.64(9H, m) , 7.01(1H, s) , 6.68(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 5.86(1H, q, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 524(M^++1)

実施例 1 1 8 : 1-(3-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

ル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(68mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1(7ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール(75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(83mg,収率67%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.45(1H, dd, $J=6.6\text{Hz}$), 8.15(1H, slike), 7.16-7.74(7H, m), 7.02(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 6.54(1H, d, $J=6.1\text{Hz}$), 5.86(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$), 4.17(3H, s), 4.11(3H, s), 2.27(3H, s), 2.10(3H, s), 1.62(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z): 552(M^++1)

実施例 1 1 9 : 1-(3-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(88mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1(9ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(138mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ブロモ- α -メチルベンジルアルコール(75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg,収率55%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.40-8.50(1H, m), 8.15(1H, slike), 7.89(1H, bs), 7.20-7.66(5H, m), 6.95(1H, s), 6.56(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$), 6.50(1H, bs), 5.86(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$), 4.17(3H, s), 4.10(3H, s), 2.30(3H, s), 2.11(3H, s), 1.62(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z): 552(M^++1)

実施例 1 2 0 : 1-(3-ブロモフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾ

リニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(74mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ブromo- α -メチルベンジルアルコール (75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg, 収率44%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.76(1H, s) , 8.06(1H, s) , 7.16-7.62(8H, m) , 6.85(1H, bs) , 5.85(1H, q, J=6.6Hz) , 4.18(3H, s) , 4.11(3H, s) , 1.65(3H, d, J=6.6Hz)
質量分析値(ESI-MS, m/z) : 525(M^++1)

実施例 1 2 1 : 1-(3-ブromoフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (119mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ブromo- α -メチルベンジルアルコール (75mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg, 収率40%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.80(1H, s) , 8.35(1H, d, J=9.0Hz) , 8.12(1H, s) , 7.54-7.60(2H, m) , 7.44-7.58(1H, m) , 7.15-7.36(4H, m) , 5.86(1H, q, J=6.7Hz) , 4.19(3H, s) , 4.16(3H, s) , 1.63(3H, d, J=6.7Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 560(M^++1)

実施例 1 2 2 : 1-(2-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (77mg) をトルエン/トリエ

チルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(117mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール(55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(101mg, 収率78%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 524(M⁺+1)

実施例 1 2 3 : 1-(2-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(74mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (103mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率73%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.37(1H, dd, J=6.6Hz) , 8.08(1H, slike) , 7.67(1H, d, J=8.1Hz) , 7.59(1H, s) , 7.37(1H, dd, J=7.1Hz) , 7.10(1H, dd, J=7.4Hz) , 7.01(1H, dd, J=9.4Hz) , 6.93(1H, d, J=8.8Hz) , 6.50(1H, s) , 6.46(1H, d, J=6.6Hz) , 6.10(1H, q, J=6.6Hz) , 4.10(3H, s) , 4.04(3H, s) , 2.22(3H, s) , 2.02(3H, s) , 1.59(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M⁺+1)

実施例 1 2 4 : 1-(2-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(71mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (99mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-フ

ルオロ- α -メチルベンジルアルコール (55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg, 収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.45(1H, dd, $J=6.5\text{Hz}$) , 8.15(1H, d, $J=4.2\text{Hz}$) , 7.91(1H, s) , 7.64(1H, s) , 7.42-7.45(1H, m) , 7.28-7.33(1H, m) , 7.06-7.11(1H, m) , 7.15-7.20(1H, m) , 6.94(1H, s) , 6.56(1H, d, $J=6.5\text{Hz}$) , 6.52(1H, s) , 6.17(1H, q, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 2.29(3H, s) , 2.11(3H, s) , 1.66(3H, d, $J=6.7\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492(M^++1)

実施例 1 2 5 : 1-(2-フルオロフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (136mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(79mg, 収率52%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.74(1H, s) , 8.06(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.54(2H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 7.39-7.43(1H, m) , 7.23-7.32(1H, m) , 7.12-7.17(3H, m) , 7.03-7.08(1H, m) , 6.86(1H, s) , 6.14(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 1.62(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 464(M^++1)

実施例 1 2 6 : 1-(2-フルオロフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(83mg) をトル

エン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (134mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-フルオロ- α -メチルベンジルアルコール (55mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(60mg, 収率45%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.80(1H, s) , 8.37(1H, d, $J=9.2\text{Hz}$) , 8.15(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.43-7.52(1H, m) , 7.32(1H, d, $J=2.7\text{Hz}$) , 7.28-7.35(1H, m) , 7.15-7.20(2H, m) , 7.06-7.11(1H, m) , 6.19(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.19(3H, s) , 4.12(3H, s) , 1.66(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 499(M^++1)

実施例 1 2 7 : 1-(2-エトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(122mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-エトキシ- α -メチルベンジルアルコール(70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(98mg, 収率69%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.46(1H, dd, $J=6.5\text{Hz}$) , 8.14(1H, s, like) , 7.58-7.64(3H, m) , 7.38-7.42(1H, m) , 7.16-7.18(2H, m) , 6.85-7.00(3H, m) , 6.68(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.31(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 4.05-4.13(2H, m) , 1.59(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$) , 1.44(3H, t, $J=7.1\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 490(M^++1)

実施例 1 2 8 : 1-(2-エトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-エトキシ- α -メチルベンジルアルコール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(71mg,収率58%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.42(1H, d, $J=6.5\text{Hz}$) , 8.13(1H, slike) , 7.73-7.80(1H, m) , 7.64(1H, s) , 7.10-7.40(2H, m) , 6.80-7.00(3H, m) , 6.48-6.53(1H, m) , 6.28(1H, q, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 4.02-4.10(2H, m) , 2.24(3H, s) , 2.07(3H, s) , 1.57(3H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 1.42(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 518(M^++1)

実施例 1 2 9 : 1-(2-エトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-エトキシ- α -メチルベンジルアルコール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg,収率55%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.42(1H, dd, $J=6.3\text{Hz}$) , 8.13(1H, slike) , 7.93(1H, bs) , 7.38(1H, d, $J=7.6\text{Hz}$) , 6.83-6.99(4H, m) , 6.53-6.58(1H, m) , 6.49(1H, bs) , 6.29(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 4.04-4.11(2H, m) , 2.27(3H, s) , 2.08(3H, s) , 1.58(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$) , 1.43(3H, t, $J=6.9\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 518(M^++1)

実施例 1 3 0 : 1-(2-エトキシフェニル)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナ

ゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (117mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-エトキシ- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(63mg, 収率46%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.74(1H, slike) , 8.05(1H, s) , 7.53-7.59(3H, m) , 7.34-7.38(1H, m) , 7.13-7.26(3H, m) , 6.82-6.98(3H, m) , 6.27(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 4.02-4.10(2H, m) , 1.56(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$) , 1.42(3H, t, $J=7.0\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 491(M^++1)

実施例 131 : 1-(2-エトキシフェニル)エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (109mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-エトキシ- α -メチルベンジルアルコール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(58mg, 収率43%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.80(1H, s) , 8.40(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 8.13(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.14-7.45(4H, m) , 6.86-7.01(3H, m) , 6.32(1H, q, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.19(3H, s) , 4.12(3H, s) , 4.05-4.13(2H, m) , 1.61(3H, d, $J=6.3\text{Hz}$) , 1.39-1.45(3H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 525(M^++1)

実施例 1 3 2 : 1-(4-メチルフェニル)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(109mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチル- α -メチルベンジルアルコール(50mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(98mg, 収率81%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.40-8.45(1H, m) , 8.11(1H, s) , 7.61(1H, s) , 7.53-7.59(2H, m) , 7.10-7.32(6H, m) , 6.78-6.85(1H, m) , 6.65(1H, d, J=6.6Hz) , 5.87(1H, q, J=6.6Hz) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.34(3H, s) , 1.60(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 460(M^++1)

実施例 1 3 3 : 1-(4-メチルフェニル)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチル- α -メチルベンジルアルコール (50mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(97mg, 収率75%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.40-8.45(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.73(1H, d, J=8.3Hz) , 7.64(1H, s) , 7.15-7.32(4H, m) , 6.97(1H, d, J=8.8Hz) , 6.51(1H, d, J=6.6Hz) , 6.48(1H, s) , 5.87(1H, q, J=6.5Hz) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.34(3H, s) , 2.22(3H, s) , 2.06(3H, s) , 1.60(3H, d, J=6.4Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 488($M^+ + 1$)

実施例 134 : 1-(4-メチルフェニル)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチル- α -メチルベンジルアルコール(50mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率68%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41-8.47(1H, m) , 8.12(1H, s) , 7.90(1H, s) , 7.62(1H, s) , 7.15-7.33(4H, m) , 6.91(1H, s) , 6.54(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.45(1H, s) , 5.87(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.34(3H, s) , 2.22(3H, s) , 2.08(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 488($M^+ + 1$)

実施例 135 : 1-(4-メチルフェニル)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-メチル- α -メチルベンジルアルコール(52mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(85mg, 収率67%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.74(1H, s) , 8.03(1H, s) , 7.43-7.60(3H, m) , 6.74-7.30(6H, m) , 6.45(1H, bs) , 5.80-5.90(1H, m) , 4.14(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.33(3H, s) , 1.59(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 461($M^+ + 1$)

実施例 136 : 1-(4-メチルフェニル)エチルN-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (106mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-メチル- α -メチルベンジルアルコール(48mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg, 収率49%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.78(1H, s) , 8.35(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 8.12(1H, s) , 7.55(1H, s) , 7.12-7.34(7H, m) , 5.83-5.91(1H, m) , 4.17(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.34(3H, s) , 1.62(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 405($M^+ + 1$)

実施例 137 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(118mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール(66mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(48mg, 収率35%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.49(1H, M) , 8.13(1H, s) , 7.62(1H, s) , 7.55(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 7.09-7.35(6H, m) , 6.75(1H, s) , 6.66(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.33(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.15(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 2.31(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 492($M^+ + 1$)

実施例 138 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (56mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(53mg, 収率43%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.40-8.46(1H, m) , 8.13(1H, s) , 7.63-7.74(2H, m) , 6.98-7.36(5H, m) , 5.53(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.43(1H, s) , 4.33(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 3.16(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 2.30(6H, s) , 2.23(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 520(M^++1)

実施例 139 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(74mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (103mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (58mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg, 収率40%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.41-8.48(1H, m) , 8.13(1H, s) , 7.85(1H, s) , 7.62(1H, s) , 6.92-7.35(5H, m) , 6.55(1H, d, $J=6.1\text{Hz}$) , 6.39(1H, s) , 4.33(1H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.16(2H, t, $J=6.7\text{Hz}$) , 2.31(3H, s) , 2.24(3H, s) , 2.14(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 520(M^++1)

実施例 140 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(69mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (105mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (59mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(29mg, 収率24%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.76(1H, s) , 8.10(1H, s) , 7.59(1H, s) , 7.49-7.56(2H, m) , 6.70-7.33(7H, m) , 4.32(2H, t, J=6.7Hz) , 4.17(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.14(2H, t, J=6.7Hz) , 2.31(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 493(M⁺+1)

実施例 141 : 3-[(4-メチルフェニル)スルファニル]エチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (102mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(4-メチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (57mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(57mg, 収率30%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.79(1H, s) , 8.32(1H, d, J=9.3Hz) , 8.13(1H, s) , 7.56(1H, s) , 7.08-7.36(7H, m) , 4.35(2H, t, J=6.7Hz) , 4.18(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.16(2H, t, J=6.7Hz) , 2.30(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 527(M⁺+1)

実施例 142 : 3-(2-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4

-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(106mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール(60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(60mg,収率55%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.44-8.47(1H, m) , 8.11-8.13(1H, m) , 7.54-7.60(2H, m) , 7.61(1H, s) , 7.14-7.18(2H, m) , 7.01-7.08(2H, m) , 6.86-6.98(3H, m) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 4.11-4.20(2H, m) , 4.34-4.44(2H, m) , 2.12-2.24(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 494(M⁺+1)

実施例 1 4 3 : 3-(2-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (57mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg,収率63%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.41-8.46(1H, m) , 8.13-8.14(1H, d, J=3.9Hz) , 7.72(1H, slike) , 7.64(1H, s) , 5.94-7.09(3H, m) , 6.87-6.93(1H, m) , 6.53(1H, d, J=6.6Hz) , 6.47(1H, s) , 4.42(1H, t, J=6.2Hz) , 4.35(1H, t, J=6.2Hz) , 4.15-4.20(2H, m) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.08(3H, s) , 2.14-2.25(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 522(M⁺+1)

実施例 1 4 4 : 3-(2-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(71mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(2-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (61mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (53mg, 収率 42%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.45-8.49(1H, m) , 8.13(1H, d like) , 7.87(1H, s) , 7.62(1H, s) , 6.87-7.09(4H, m) , 6.56(1H, d, J=6.3Hz) , 6.45(1H, s) , 4.42(1H, d, J=6.2Hz) , 4.36(1H, d, J=6.2Hz) , 4.13-4.20(2H, m) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.05-2.24(2H, m) , 2.26(3H, s) , 2.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 522(M⁺+1)

実施例 1 4 5 : 3-(2-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(65mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (90mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(2-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (51mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (52mg, 収率 46%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.74(1H, s) , 7.96(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.52-7.56(1H, m) , 7.16-7.21(2H, m) , 6.77-7.08(5H, m) , 4.40(1H, t, J=6.2Hz) , 4.34(1H, t, J=6.2Hz) , 4.07-4.19(2H, m) , 4.14(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.03-2.27(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 494($M^+ + 1$)。

実施例 1 4 6 : 3-(2-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(65mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (90mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (51mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(52mg,収率46%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.69(1H, slike) , 8.07(1H, s) , 7.65(1H, bs) , 7.57(1H, s) , 6.80-6.87(1H, m) , 6.89-7.04(4H, m) , 4.35(1H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.28(1H, d, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.08-4.14(2H, m) , 4.12(3H, s) , 4.06(3H, s) , 2.05-2.19(2H, m) , 2.00(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 523($M^+ + 1$)。

実施例 1 4 7 : 3-(3-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (71mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(108mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール(61mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg,収率69%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44-8.48(1H, m) , 8.12(1H, d, $J=3.7\text{Hz}$) , 7.61(1H, s) , 7.57-7.61(2H, m) , 7.14-7.21(3H, m) , 6.92(1H, d, $J=9.2\text{Hz}$) , 6.57-6.68(3H, m) , 4.39(1H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.35(1H, d, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.12(3H, s) , 4.08(3H, s) ,

4.05-4.09(2H,m) , 2.12-2.1(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 494(M⁺+1)

実施例 1 4 8 : 3-(3-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(66mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (92mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (52mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(63mg, 収率55%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.41-8.45(1H,m) , 8.14(1H,d,J=3.9Hz) , 7.72(1H,bs) , 7.64(1H,s) , 7.16-7.22(1H,m) , 7.00(1H,dd,J=8.8Hz,J=5.6Hz) , 6.58-6.70(2H,m) , 6.53(1H,d,J=6.6Hz) , 6.43-6.49(1H,m) , 4.39(1H,t,J=6.2Hz) , 4.35(1H,t,J=6.2Hz) , 4.15(3H,s) , 4.10(3H,s) , 4.05-4.10(2H,m) , 2.25(3H,d,J=4.9Hz) , 2.08(3H,s,J=3.2Hz) , 2.13-2.21(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 522(M⁺+1)

実施例 1 4 9 : 3-(3-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(79mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (62mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(74mg, 収率54%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.45-8.50(1H,m) , 8.12(1H,d,J=3.7Hz) , 7.86(1H,bs) ,

7.62(1H,s) , 7.16-7.25(1H,m) , 6.93(1H,d,J=3.2Hz) , 6.54-6.70(3H,m) , 6.43-6.47(1H,m) , 4.39(1H,t,J=6.2Hz) , 4.36(1H,t,J=6.2Hz) , 4.14(3H,s) , 4.08(3H,s) , 4.05-4.10(2H,m) , 2.26(3H,d,J=4.6Hz) , 2.10(3H,d,J=5.4H) , 2.13-2.22(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 522(M⁺+1)

実施例 150 : 3-(3-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (124mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(59mg,収率46%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.69(1H,s) , 8.01(1H,s) , 7.54(1H,s) , 7.46-7.54(2H,m) , 7.10-7.15(3H,m) , 6.76-6.85(1H,m) , 6.51-6.64(2H,m) , 4.32(1H,t,J=6.2Hz) , 4.29(1H,t,J=6.2Hz) , 4.10(3H,s) , 4.04(3H,s) , 3.96-4.04(2H,m) , 2.05-2.15(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 494(M⁺+1)。

実施例 151 : 3-(3-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (94mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (53mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することによ

り、表題の化合物を(68mg,収率56%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ,400MHz): 8.74(1H,s), 8.08(1H,s), 7.67(1H,bs), 7.61(1H,s), 7.14-7.23(1H,m), 6.96-7.02(1H,m), 6.55-6.68(2H,m), 6.43-6.53(1H,m), 4.30-4.38(2H,m), 4.16(3H,s), 4.10(3H,s), 4.03-4.10(2H,m), 2.22-2.25(3H,m), 2.10-2.18(2H,m), 2.04-2.07(3H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z): 523(M^++1)。

実施例 152: 3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (71mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(108mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール(61mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(81mg,収率64%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ,400MHz): 8.45(1H,d, $J=4.2\text{Hz}$), 8.12(1H,d, $J=3.6\text{Hz}$), 7.62(1H,s), 7.56-7.62(2H,m), 7.14-7.18(2H,m), 6.94-6.98(1H,m), 6.80-6.89(2H,m), 6.67(1H,d, $J=6.4\text{Hz}$), 4.39(1H,t, $J=6.2\text{Hz}$), 4.36(1H,t, $J=6.2\text{Hz}$), 4.14(3H,s), 4.08(3H,s), 4.04(2H,t, $J=6.0\text{Hz}$), 2.12-2.20(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z): 494(M^++1)

実施例 153: 3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(66mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (92mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (52mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、

濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(79mg, 収率70%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44(1H, dd, $J=6.2\text{Hz}$) , 8.13(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$) , 7.72(1H, bs) , 7.64(1H, s) , 6.92-7.02(3H, m) , 6.81-6.85(1H, m) , 6.53(1H, d, $J=6.2\text{Hz}$) , 6.48(1H, d, $J=5.6\text{Hz}$) , 4.39(1H, t, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.35(1H, t, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 4.04(2H, t, $J=6.1\text{Hz}$) , 2.25(3H, d, $J=6.3\text{Hz}$) , 2.08(3H, d, $J=3.2\text{Hz}$) , 2.13-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 522(M^++1)

実施例 154 : 3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (94mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (54mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(68mg, 収率58%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.49(1H, dd, $J=6.5\text{Hz}$) , 8.10(1H, s) , 7.85(1H, bs) , 7.61(1H, s) , 6.78-6.97(4H, m) , 6.56(1H, d, $J=6.3\text{Hz}$) , 6.50(1H, d, $J=6.8\text{Hz}$) , 4.38(1H, t, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.34(1H, t, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.13(3H, s) , 4.13(3H, s) , 4.07(3H, s) , 4.04(2H, t, $J=6.0\text{Hz}$) , 2.25(3H, d, $J=5.6\text{Hz}$) , 2.09(3H, d, $J=5.1\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 522(M^++1)

実施例 155 : 3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(59mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (89mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (51mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌し

た。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg, 収率49%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.73(1H, s) , 7.97(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.53-7.57(2H, m) , 7.16-7.19(2H, m) , 6.89-6.98(2H, m) , 6.78-6.85(2H, m) , 4.37(1H, t, J=6.3Hz) , 4.34(1H, t, J=6.3Hz) , 4.14(3H, s) , 4.09(3H, s) , 4.03(2H, t, J=6.3Hz) , 2.08-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 494(M⁺+1)。

実施例 156 : 3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (94mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(4-フルオロフェノキシ)-1-プロパノール (53mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(48mg, 収率41%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.71(1H, s) , 7.91(1H, s) , 7.66(1H, bs) , 7.61(1H, s) , 6.91-7.02(3H, m) , 6.78-6.84(2H, m) , 6.44(1H, bs) , 4.37(1H, t, J=6.5Hz) , 4.33(1H, t, J=6.5Hz) , 4.14(3H, s) , 4.10(3H, s) , 4.00-4.08(2H, m) , 2.23(3H, d, J=6.1Hz) , 2.06(3H, d, J=3.2Hz) , 2.10-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 523(M⁺+1)。

実施例 157 : 3-(2-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(109mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、 3-(2-メトキ

シフェノキシ)-1-プロパノール(66mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(91mg,収率69%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.47(1H,bs) , 8.12(1H,s) , 7.61(1H,s) , 7.55-7.60(2H,m) , 7.13-7.18(2H,m) , 6.85-6.95(4H,m) , 6.68(1H,bs) , 4.42(2H,t,J=6.2 Hz) , 4.12-4.20(2H,m) , 4.14(3H,s) , 4.08(3H,s) , 3.85(3H,s) , 2.17-2.26(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 506($\text{M}^+ + 1$)

実施例 158 : 3-(2-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (97mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg,収率63%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43(1H,dd,J=6.6Hz) , 8.14(1H,dlike,J=4.1Hz) , 7.72(1H,bs) , 7.64(1H,s) , 6.99(1H,d,J=8.8Hz) , 6.86-6.96(4H,m) , 6.53(1H,d,J=6.6Hz) , 6.47(1H,bs) , 4.41(2H,t,J=6.3Hz) , 4.15(3H,s) , 4.15(2H,t,J=6.2Hz) , 4.09(3H,s) , 3.85(3H,s) , 2.24(3H,s) , 2.07(3H,s) , 2.19-2.26(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534($\text{M}^+ + 1$)

実施例 159 : 3-(2-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(68mg) をトル

エン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (94mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (60mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg, 収率51%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.44(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 8.14(1H, dlike, $J=3.9\text{Hz}$) , 7.87(1H, bs) , 6.87-6.97(5H, m) , 7.62(1H, s) , 6.56(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.43(1H, bs) , 4.42(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.15(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.08(3H, s) , 3.85(3H, s) , 2.23(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 2.26(3H, s) , 2.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M^++1)

実施例 160 : 3-(2-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (114mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (69mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg, 収率35%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.71(1H, s) , 8.04(1H, s) , 7.54(1H, s) , 7.46-7.53(2H, m) , 6.70-7.20(7H, m) , 4.36(1H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.30(1H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.12(3H, s) , 4.05(3H, s) , 4.05-4.11(2H, m) , 3.79(3H, s) , 2.10-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 507(M^++1)。

実施例 161 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (70mg) をトルエン/トリエ

チルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(106mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール(64mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(69mg,収率54%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.45(1H, dd, $J=6.3\text{Hz}$) , 8.13(1H, dlike, $J=3.9\text{Hz}$) , 7.62(1H, s) , 7.55-7.65(3H, m) , 7.12-7.18(3H, m) , 6.65-6.75(1H, m) , 6.43-6.52(1H, m) , 6.44-6.47(1H, m) , 4.22-4.41(2H, m) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 4.05-4.14(2H, m) , 3.76(3H, s) , 2.14-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 506(M^++1)

実施例 162 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(72mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(100mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール(61mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(83mg,収率66%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.39(1H, dlike, $J=6.7\text{Hz}$) , 8.08(1H, dlike, $J=3.4\text{Hz}$) , 7.60-7.70(1H, m) , 7.59(1H, s) , 7.11(1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$) , 6.94(1H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 6.39-6.50(4H, m) , 4.34(2H, t, $J=6.3\text{Hz}$) , 4.09(3H, s) , 4.04(3H, s) , 4.01(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 3.72(3H, s) , 2.19(3H, s) , 2.08-2.15(2H, m) , 2.02(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M^++1)

実施例 163 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(73mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (101mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (62mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (59mg, 収率 46%) 得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.45-8.55(1H, m) , 8.11(1H, s) , 7.86(1H, s) , 7.62(1H, s) , 7.16(1H, dd, $J=8.2\text{Hz}$) , 6.92(1H, s) , 6.56(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.40-6.52(4H, m) , 4.39(2H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 4.07(2H, t, $J=6.4\text{Hz}$) , 3.77(3H, s) , 2.26(3H, s) , 2.14-2.22(2H, m) , 2.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M^++1)

実施例 164 : 3-(3-メトキシフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (114mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-メトキシフェノキシ)-1-プロパノール (69mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (51mg, 収率 35%) 得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.71(1H, s) , 8.04(1H, s) , 7.54(1H, s) , 7.46-7.53(2H, m) , 6.70-7.20(7H, m) , 4.36(1H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.30(1H, t, $J=6.2\text{Hz}$) , 4.12(3H, s) , 4.05(3H, s) , 4.05-4.11(2H, m) , 3.79(3H, s) , 2.10-2.20(2H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 507(M^++1)。

実施例 165 : 2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(105mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (78)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(105収率74)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.43-8.48(1H, m) , 8.13(1H, d like, $J=3.9\text{Hz}$) , 7.62(1H, s) , 7.56(2H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 7.16(2H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 7.02(2H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 6.84(1H, s) , 6.76(1H, s) , 6.67(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.35(2H, t, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.18(2H, t, $J=6.6\text{Hz}$) , 2.27(6H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 506(M^++1)

実施例 166 : 2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(62) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (61) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (85)加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (55)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(88mg, 収率81%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.44(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 8.14(1H, s, $J=4.2\text{Hz}$) , 7.72(1H, b s) , 7.64(1H, s) , 7.01-7.04(2H, m) , 6.99(1H, s) , 6.84(1H, s) , 6.53(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 6.43(1H, s) , 3.71(1H, t, $J=6.0\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 3.19(2H, t, $J=6.0\text{Hz}$) , 2.27(6H, s) , 2.23(3H, s) , 2.08(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M^++1)

実施例 167 : 2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-

ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (97mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (60mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(79mg, 収率66%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.45(1H, dd, J=6.6Hz) , 8.13(1H, d, J=4.2Hz) , 7.86(1H, s) , 7.62(1H, s) , 7.02(2H, s) , 6.93(1H, s) , 6.84(1H, s) , 6.55(1H, d, J=6.6 Hz) , 6.40(1H, s) , 4.36(1H, t, J=6.7Hz) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.20(2 H, t, J=6.7Hz) , 2.27(6H, s) , 2.24(3H, s) , 2.11(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 534(M⁺+1)

実施例 168 : 2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (108mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-エタノール (65mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(101mg, 収率79%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.77(1H, s) , 8.09(1H, s) , 7.59(1H, s) , 7.53(2H, d, J=9.0Hz) , 7.17(2H, d, J=8.8Hz) , 6.97-7.03(2H, m) , 6.72-6.85(2H, m) , 4.34(2 H, t, J=6.6Hz) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 3.17(2H, t, J=6.6Hz) , 2.27(6H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 507(M⁺+1)。

実施例 169 : 3-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]プロピル N-{4-[(6,

7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(105mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (78mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(48mg,収率37%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz): 8.45(1H,dd,J=6.6Hz), 8.12(1H,s), 7.62(1H,s), 7.56-7.61(2H,m), 7.15-7.61(2H,m), 7.15-7.25(3H,m), 6.96(1H,s), 6.80-6.85(1H,m), 6.67(1H,d,J=6.4Hz), 4.36(1H,t,J=6.4Hz), 4.31(1H,t,J=6.4Hz), 4.14(3H,s), 4.08(3H,s), 3.00(2H,t,J=7.1Hz), 2.27(6H,s), 1.97-2.25(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z): 520(M⁺+1)

実施例 170: 3-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(72mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) 加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(33mg,収率25%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz): 8.40-8.46(1H,m), 8.14(1H,s), 7.73(1H,bs), 7.65(1H,s), 6.94-7.02(3H,m), 6.82-7.02(3H,m), 6.82(1H,s), 6.53(1H,d,J=6.6Hz), 6.43-6.48(1H,m), 4.28-4.37(2H,m), 4.15(3H,s), 4.09(3H,s), 4.00(2H,t,J=7.1Hz), 2.27(6H,s), 2.25(3H,s), 2.08(3H,s), 1.98-2.20(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 548($M^+ + 1$)

実施例 171 : 3-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(68mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (97mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(51mg, 収率42%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.41-8.45(1H, m) , 8.14(1H, bs) , 7.68(1H, bs) , 7.62(1H, s) , 6.97(1H, s) , 6.92-6.96(1H, m) , 6.82(1H, s) , 6.56(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 6.40-6.45(1H, m) , 4.36(1H, t, $J=6.0\text{Hz}$) , 4.32(1H, t, $J=6.0\text{Hz}$) , 3.00(2H, t, $J=7.1\text{Hz}$) , 2.27(6H, s) , 2.26(3H, s) , 2.14-2.20(1H, m) , 2.11(3H, s) , 1.98-2.05(1H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 548($M^+ + 1$)

実施例 172 : 3-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(66mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (100mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-[(2,5-ジメチルフェニル)スルファニル]-1-プロパノール (70mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(29mg, 収率23%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.75(1H, s) , 8.07(1H, s) , 7.59(1H, s) , 7.52-7.58(2H, m) , 6.79-7.21(5H, m) , 4.34(1H, d, $J=6.1\text{Hz}$) , 4.30(1H, d, $J=6.1\text{Hz}$) , 4.16(3H,

s) , 4.10(3H,s) , 2.99(2H,t,J=7.1Hz) , 2.27(6H,s) , 2.11-2.19(1H,m) , 2.15-2.03(1H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 521(M^+ +1)。

実施例 173 : 3-(2-ピリジルスルファニル)プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) 加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-ピリジルスルファニル)-1-プロパノール (63mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(18mg,収率13%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.39-8.44(2H,m) , 7.90-7.95(1H,m) , 7.64-7.70(1H,m) , 7.63(1H,s) , 7.44-7.50(1H,m) , 7.15-7.20(1H,m) , 6.95-7.02(2H,m) , 6.42-6.48(1H,m) , 4.33(2H,t,J=6.2Hz) , 4.12(3H,s) , 4.08(3H,s) , 3.29(2H,t,J=7.1Hz) , 2.25(3H,s) , 2.09-2.15(2H,m) , 2.09(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 521(M^+ +1)

実施例 174 : 3-(2-ピリジルスルファニル)プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-ピリジルスルファニル)-1-プロパノール (62mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(13mg,収率10%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75-8.79(1H,m) , 8.41-8.47(1H,m) , 8.12(1H,s) , 8.

06-8.14(1H,m) , 7.99(1H,bs) , 7.81(1H,s) , 7.69(1H,d,J=8.5Hz) , 7.63(1H,slike) , 7.52-7.58(1H,m) , 6.92(1H,s) , 6.58(1H,d,J=6.3Hz) , 4.30(2H,t,J=5.6Hz) , 4.14(3H,s) , 4.09(3H,s) , 3.99(2H,t,J=7.3Hz) , 2.40(3H,s) , 2.08-2.22(2H,m) , 2.08(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 521(M⁺+1)

実施例 175 : 3-(2-ピリジルスルファニル)プロピルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(73mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-(2-ピリジルスルファニル)-1-プロパノール (62mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(5mg,収率4%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 494(M⁺+1)。

実施例 176 : 4-クロロ-2-メチルフェニル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリノ}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (88mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(70mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-メチル-4-クロロチオフェノール(70mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(108mg,収率70%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 482 (M⁺+1)

実施例 177 : 4-クロロ-2-メチルフェニル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリノ}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(82mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (114mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-メチル-4-クロロチオフェノール (60mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(91mg,収率66%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 510($M^+ + 1$)

実施例 178 : 4-クロロ-2-メチルフェニル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(79mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-メチル-4-クロロチオフェノール (58mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(71mg,収率53%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 510($M^+ + 1$)

実施例 179 : 4-クロロ-2-メチルフェニル {4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン}メタンチオエート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg)をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml)に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (121mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-メチル-4-クロロチオフェノール (64mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物

を(68mg,収率49%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 493(M^++1)

実施例 180 : 1-[3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(124mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメトキシ- α -メチルベンジルアルコール(85mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg,収率39%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.39(1H, dd, $J=6.6\text{Hz}$) , 8.07(1H, slike) , 7.50-7.56(2H, m) , 7.31-7.36(3H, m) , 7.23-7.28(1H, m) , 7.08-7.13(2H, m) , 6.82(1H, s) , 6.60(1H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 5.85(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.09(3H, s) , 4.02(3H, s) , 1.55(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 529(M^++1)

実施例 181 : 1-[3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(88mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (122mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメトキシ- α -メチルベンジルアルコール (83mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(73mg,収率46%)得た。

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3, 400\text{MHz})$: 8.42(1H, dd, $J=6.5\text{Hz}$) , 8.13(1H, s) , 7.63-7.75(2H, m) , 6.96-7.42(5H, m) , 6.51(2H, d, $J=6.5\text{Hz}$) , 5.89(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.15(3H,

s) , 4.09(3H,s) , 2.24(3H,s) , 2.07(3H,s) , 1.61(3H,d,J=6,6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 558(M⁺+1)

実施例 182 : 1-[3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメトキシ- α -メチルベンジルアルコール (85mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg, 収率48%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.43(1H, dd, J=6.6Hz) , 8.13(1H, s) , 7.85(1H, s) , 7.62(1H, s) , 7.40(1H, dd, J=7.8Hz) , 7.31(1H, d, J=7.8Hz) , 7.16(1H, d, J=8.0Hz) , 6.93(1H, s) , 6.54(1H, d, J=6.6Hz) , 6.48(1H, s) , 5.89(1H, q, J=6.7Hz) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.27(3H, s) , 2.09(3H, s) , 1.62(3H, d, J=6.7Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 558(M⁺+1)

実施例 183 : 1-[3-(トリフルオロメトキシ)フェニル]エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (124mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、4-トリフルオロメトキシ- α -メチルベンジルアルコール (85mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(48mg, 収率31%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.75(1H, s) , 8.11(1H, s) , 7.53-7.59(3H, m) , 7.38(1H, dd, J=7.9Hz) , 7.30(1H, d, J=7.9Hz) , 7.12-7.19(3H, m) , 6.87(1H, s) , 5.89(1

H, q, J=6.6Hz) , 4.16(3H, s) , 4.10(3H, s) , 1.60(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 530(M⁺+1)

実施例 184 : 1-フェニルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(118mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、1-フェニル-1-ブタノール(59mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg, 収率58%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.43(1H, dd, J=6.6Hz) , 8.12(1H, slike) , 7.60(1H, s) , 7.53-7.58(2H, m) , 7.23-7.38(4H, m) , 7.12-7.15(2H, m) , 6.80(1H, s) , 6.64(1H, d, J=6.6Hz) , 5.72-5.78(1H, m) , 4.14(3H, s) , 4.07(3H, s) , 1.75-2.03(2H, m) , 1.35-1.45(2H, m) , 0.94(2H, d, J=7.3Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 474(M⁺+1)

実施例 185 : 1-フェニルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(90mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (125mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、1-フェニル-1-ブタノール (62mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(59mg, 収率40%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.36(1H, dd, J=6.5Hz) , 8.08(1H, s) , 7.67(1H, d, J=8.8Hz) , 7.59(1H, s) , 7.24-7.34(5H, m) , 6.92(1H, d, J=8.8Hz) , 6.42-6.47(2H, m)

, 5.69(1H, t, J=6.9Hz) , 4.10(3H, s) , 4.04(3H, s) , 2.18(3H, s) , 2.01(3H, s) , 1.70-2.00(2H, m) , 1.2-1.42(2H, m) , 0.90(3H, t, J=7.4Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 502(M⁺+1)

実施例 186 : 1-フェニルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(89mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (126mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、1-フェニル-1-ブタノール (63mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(58mg, 収率39%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.43(1H, dd, J=6.5Hz) , 8.12(1H, slike) , 7.89(1H, s) , 7.61(1H, s) , 7.26-7.40(5H, m) , 6.91(1H, s) , 6.53(1H, d, J=6.5Hz) , 6.47(1H, s) , 5.71-5.76(1H, m) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.07(3H, s) , 1.75-2.05(2H, m) , 1.25-1.50(2H, m) , 0.95(3H, t, J=7.3Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 502(M⁺+1)

実施例 187 : 1-フェニルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、1-フェニル-1-ブタノール (57mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(38mg, 収率29%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.71(1H, s) , 8.07(1H, s) , 7.54(1H, s) , 7.44-7.52(2H,

m), 7.18-7.33(5H,m), 7.08-7.13(2H,m), 6.73(1H,s), 5.65-5.72(1H,m), 4.12(3H,s), 4.05(3H,s), 1.65-1.95(2H,m), 1.30-1.40(2H,m), 0.89(3H,t, J=7.4Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 475(M⁺+1)

実施例 188 : 2-(ジメチルアミノ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(40mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ジメチルアミノエタノール(40mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(31mg, 収率25%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.41(1H,d, J=5.4Hz), 7.56-7.65(2H,m), 7.43(1H,s), 7.20-7.26(2H,m), 6.97(1H,d, J=8.8Hz), 6.25(1H,d, J=5.1Hz), 4.34-4.41(2H,m), 4.05(2H,s), 4.04(3H,s), 2.92(2H,bs), 2.57(6H,bs)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 412(M⁺+1)

実施例 189 : 2-(ジメチルアミノ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ジメチルアミノエタノール (31mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(41mg, 収率35%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.41(1H,d, J=5.3Hz), 7.59(2H,s), 7.42(1H,s), 6.96

(1H, d, H=8.8Hz) , 6.24(1H, d, J=5.3Hz) , 4.30-4.38(2H, m) , 4.04(3H, s) , 4.03(3H, s) , 2.81(2H, bs) , 2.47(6H, bs) , 2.25(3H, s) , 2.09(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 441(M⁺+1)

実施例 190 : 2-(ジメチルアミノ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(85mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (9ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (115mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ジメチルアミノエタノール (33mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(28mg, 収率22%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) :

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 441(M⁺+1)

実施例 191 : 2-(ジメチルアミノ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(74mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (112mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-ジメチルアミノエタノール (32mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(13mg, 収率12%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.42(1H, m) , 8.07(1H, s) , 7.10-7.70(5H, m) , 6.62-6.68(1H, m) , 4.47-4.52(2H, m) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 3.30-3.35(2H, m) , 2.94(6H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 413(M⁺+1)

実施例 192 : 4-(ジメチルアミノ)ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(130mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-ジメチルアミノプロパノール(40mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(22mg, 収率17%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 441($M^{+1}+1$)

実施例 193 : 4-(ジメチルアミノ)ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(76mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (106mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-ジメチルアミノプロパノール (40mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(29mg, 収率25%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 469($M^{+1}+1$)

実施例 194 : 4-(ジメチルアミノ)ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (114mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、4-ジメチルアミノプロパノール (43mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸

水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(18mg,収率15%)得た。

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 413(M^++1)

実施例 195 : 2-メチル-1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (77mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(118mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-メチル-1-フェニル-1-プロパノール(39mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg,収率59%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.45(1H, m) , 8.10-8.13(1H, m) , 7.10-7.61(10H, m) , 6.62-6.65(1H, m) , 5.45(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$) , 4.14(3H, s) , 4.07(3H, s) , 2.00-2.25(1H, m) , 1.04(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$) , 0.83(3H, d, $J=6.8\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 474(M^++1)

実施例 196 : 2-メチル-1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-メチル-1-フェニル-1-プロパノール (55mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(69mg,収率52%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.38-8.43(1H, m) , 8.11-8.15(1H, m) , 7.00-7.80(8H, m)

, 6.95-7.00(1H,m) , 6.47-6.52(1H,m) , 5.45(1H,d,J=7.6Hz) , 4.14(3H,s) , 4.09(3H,s) , 2.23(3H,s) , 2.06(3H,s) , 2.00-2.25(1H,m) , 1.04(3H,d,J=6.6Hz) , 0.83(3H,d,J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 502(M⁺+1)

実施例 197 : 2-メチル-1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (124mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-メチル-1-フェニル-1-プロパノール(61mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(58mg,収率44%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃,400MHz) : 8.39-8.44(1H,m) , 8.12-8.14(1H,m) , 7.85-7.90(1H,s like) , 7.61(1H,s) , 7.24-7.36(5H,m) , 6.91(1H,s) , 6.45-6.55(2H,m) , 5.45(1H,d,J=7.8Hz) , 4.14(3H,s) , 4.08(3H,s) , 2.26(3H,s) , 2.10-2.22(1H,m) , 2.07(3H,s) , 1.05(3H,d,J=6.6Hz) , 0.83(3H,d,J=6.8Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 502(M⁺+1)

実施例 198 : 2-メチル-1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(75mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (137mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-メチル-1-フェニル-1-プロパノール (56mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(38mg,収率29%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.72(1H, s) , 8.09(1H, s) , 7.58(1H, s) , 7.55(2H, d, J=8.8Hz) , 7.20-7.36(5H, m) , 7.13-7.16(2H, m) , 6.93(1H, bs) , 5.45(1H, d, J=7.6Hz) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.09-2.18(1H, m) , 1.02(3H, d, J=6.6Hz) , 0.82(3H, d, J=6.8Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 475(M^++1)

実施例 199 : 1-[3-(ジメチルアミノ)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (78mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(120mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ジメチルアミノ- α -メチルベンジルアルコール(65mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg, 収率44%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.39(1H, d, J=5.6Hz) , 7.42-7.57(3H, m) , 7.06-7.22(2H, m) , 6.54-6.74(5H, m) , 6.42(1H, d, J=5.6Hz) , 5.80(1H, q, J=6.6Hz) , 4.01(3H, s) , 3.99(3H, s) , 2.90(3H, s) , 2.89(3H, s) , 1.56(3H, d, J=6.6Hz)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 489(M^++1)

実施例 200 : 1-[3-(ジメチルアミノ)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(83mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、3-ジメチルアミノ- α -メチルベンジルアルコール (62mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(77mg, 収率55%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41(1H, d, $J=5.4\text{Hz}$) , 7.48-7.65(3H, m) , 7.20-7.26(1H, m) , 6.96(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$) , 6.65-6.78(3H, m) , 6.42(1H, bs) , 6.25-6.30(1H, m) , 5.85(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.04-4.06(6H, m) , 2.95(6H, s) , 2.22(3H, s) , 2.08(3H, s) , 1.61(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 517(M^++1)

実施例 201 : 1-[3-(ジメチルアミノ)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (110mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-ジメチルアミノ- α -メチルベンジルアルコール (60mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(58mg, 収率43%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.41(1H, d, $J=5.6\text{Hz}$) , 7.80(1H, bs) , 7.57(1H, s) , 7.55(1H, bs) , 7.20-7.26(1H, m) , 6.89(1H, s) , 6.72-6.79(2H, m) , 6.65-6.70(1H, m) , 6.41(1H, bs) , 6.31(1H, q, $J=5.4\text{Hz}$) , 5.85(1H, q, $J=6.6\text{Hz}$) , 4.05(3H, s) , 4.05(3H, s) , 2.96(6H, s) , 2.22(3H, s) , 2.10(3H, s) , 1.62(3H, d, $J=6.6\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 517(M^++1)

実施例 202 : 1-[3-(ジメチルアミノ)フェニル]エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (120mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-ジメチルアミノ- α -メチルベンジルアルコール (66mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、

表題の化合物を(51mg,収率36%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.54(1H, s) , 7.48(1H, s) , 7.42(1H, d, $J=7.8\text{Hz}$) , 7.25(1H, s) , 7.10-7.20(3H, m) , 6.58-6.74(5H, m) , 5.80(1H, q, $J=6.5\text{Hz}$) , 3.99(3H, s) , 3.99(3H, s) , 2.90(6H, s) , 1.55(3H, d, $J=6.5\text{Hz}$)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 490(M^++1)

実施例 203 : 2-(2-フルオロフェノキシ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (60mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(91mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-エタノール(47mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(52mg,収率50%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.43-8.49(1H, m) , 8.13(1H, d, $J=3.9\text{Hz}$) , 7.62(1H, s) , 7.59(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$) , 7.17(2H, d, $J=9.0\text{Hz}$) , 6.90-7.12(5H, m) , 6.68(1H, d, $J=6.1\text{Hz}$) , 4.54-4.59(2H, m) , 4.28-4.33(2H, m) , 4.15(3H, s) , 4.08(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 479(M^++1)

実施例 204 : 2-(2-フルオロフェノキシ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(62mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (86mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-エタノール (45mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(49mg,収率47%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.40-8.45(1H, t, $J=6.5\text{Hz}$) , 8.14(1H, slike) , 7.72(1H, bs) , 7.64(1H, s) , 6.90-7.12(5H, m) , 6.59(1H, bs) , 6.53(1H, d, $J=6.4\text{Hz}$) , 4.56(2H, t, $J=4.6\text{Hz}$) , 4.30(2H, t, $J=4.6\text{Hz}$) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.08(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 508(M^++1)

実施例 205 : 2-(2-フルオロフェノキシ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(55mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (76mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-エタノール (40mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(61mg, 収率66%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.46-8.53(1H, m) , 8.11(1H, d, $J=1.7\text{Hz}$) , 7.85(1H, bs) , 7.62(1H, s) , 6.85-7.12(5H, m) , 6.54-6.64(2H, m) , 4.54-4.58(2H, m) , 4.29-4.32(2H, m) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s) , 2.26(3H, s) , 2.10(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 508(M^++1)

実施例 206 : 2-(2-フルオロフェノキシ)エチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(50mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (76mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-エタノール(40mg) を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(38mg, 収率44%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75(1H, s) , 7.99(1H, s) , 7.59(1H, s) , 7.54(2H, d, J=8.8Hz) , 7.19(2H, d, J=9.0Hz) , 6.85-7.12(5H, m) , 4.53-4.56(2H, m) , 4.28-4.32(2H, m) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 480($\text{M}^+ + 1$)

実施例 207 : 2-(3-フルオロフェノキシ)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (62mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン(92mg)を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-(3-フルオロフェノキシ)-1-エタノール(48mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(55mg, 収率51%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.43-8.49(1H, m) , 8.10-8.13(1H, m) , 7.57-7.64(3H, m) , 6.60-7.25(7H, m) , 4.52-4.57(2H, m) , 4.18-4.27(2H, m) , 4.14(3H, s) , 4.08(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 479($\text{M}^+ + 1$)

実施例 208 : 2-(3-フルオロフェノキシ)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン(70mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (7ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (97mg) を加えて15分間加熱還流した。続いて、2-(3-フルオロフェノキシ)-1-エタノール (50mg)を加え、さらに加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(78mg, 収率67%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.42-8.49(1H, m) , 8.12-8.14(1H, m) , 7.73(1H, bs) , 7.

6.4(1H, s) , 7.21(1H, d, J=8.0Hz) , 7.00(1H, d, J=8.8Hz) , 6.50-6.74(4H, m) , 4.54(2H, t, J=4.5) , 4.21(2H, t, J=4.5Hz) , 4.15(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.25(3H, s) , 2.08(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 508(M⁺+1)

実施例 209 : 2-(3-フルオロフェノキシ)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン(56mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (78mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-(3-フルオロフェノキシ)-1-エタノール (40mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (54mg, 収率 57%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.40-8.50(1H, m) , 8.11(1H, s) , 8.00(1H, s) , 7.84-7.91(1H, m) , 7.60-7.67(2H, m) , 6.40-6.99(5H, m) , 4.08-4.28(4H, m) , 4.14(3H, s) , 4.09(3H, s) , 2.26(3H, s) , 2.11(3H, s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 508(M⁺+1)

実施例 210 : 2-(3-フルオロフェノキシ)エチルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン(55mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (6ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (83mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、2-(3-フルオロフェノキシ)-1-エタノール(43mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (28mg, 収率 29%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.75(1H, m) , 8.05(1H, s like) , 7.59(1H, s) , 7.50-7.5

8(2H,m) , 7.17-7.24(2H,m) , 6.60-6.73(4H,m) , 4.52-4.56(2H,m) , 4.19-4.23(2H,m) , 4.16(3H,s) , 4.10(3H,s)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 480(M⁺+1)

実施例 2 1 1 : 3-(2-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(2-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (69mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (70mg, 収率 50%) 得た。

¹H-NMR(CDCl₃, 400MHz) : 8.74(1H,d,J=1.7Hz) , 8.08(1H,s) , 7.70(1H,bs) , 7.62(1H,s) , 7.32-7.36(1H,m) , 7.17-7.22(1H,m) , 7.00(1H,dd,J=6.8Hz,J=9.3Hz) , 6.85-6.95(2H,m) , 6.44(1H,bs) , 4.43(1H,t,J=6.2Hz) , 4.34(1H,t,J=6.2Hz) , 4.10-4.20(1H,m) , 4.18(3H,s) , 4.11(3H,s) , 3.60-3.70(1H,m) , 2.23(1H,d,J=5.9Hz) , 2.06(1H,d,J=4.1Hz) , 2.08-2.22(2H,m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 539(M⁺+1)

実施例 2 1 2 : 3-(3-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-アニリン(80mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (111mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(3-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (62mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を (65mg, 収率 46%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.75(1H, d, $J=2.7\text{Hz}$) , 8.14(1H, s) , 7.70(1H, bs) , 7.62(1H, s) , 7.15-7.22(1H, m) , 6.97-7.03(1H, m) , 6.87-6.95(1H, m) , 6.76-6.82(1H, m) , 6.42(1H, bs) , 4.32-4.39(2H, m) , 4.18(3H, s) , 4.11(3H, s) , 4.03-4.08(1H, m) , 3.62-3.68(1H, m) , 2.23-2.26(3H, m) , 2.12-2.21(2H, m) , 2.05-2.07(3H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 539(M^++1)

実施例 2 1 3 : 3-(4-クロロフェノキシ)プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-アニリン(82mg) をトルエン/トリエチルアミン=10/1 (8ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (114mg) を加えて 15 分間加熱還流した。続いて、3-(4-クロロフェノキシ)-1-プロパノール (71mg) を加え、さらに加熱還流下で 2 時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥、濃縮を行ない、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を(85mg, 収率59%)得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 400MHz) : 8.74(1H, slike) , 8.09(1H, s) , 7.69(1H, bs) , 7.62(1H, s) , 7.19-7.23(2H, m) , 7.97-7.02(1H, m) , 6.79-6.84(2H, m) , 6.42(1H, bs) , 4.32-4.39(2H, m) , 4.17(3H, s) , 4.11(3H, s) , 4.02-4.09(2H, m) , 2.23-2.26(3H, m) , 2.10-2.20(2H, m) , 2.05-2.07(3H, m)

質量分析値(ESI-MS, m/z) : 539(M^++1)

実施例 2 1 4 : 3-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (1 0 0 m g) をトルエン (1 0 m l) 、 トリエチルアミン (1 m l) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (1 5 0 m g) を加えて 1 0 分間加熱還流した。次に3-メトキシフェノール (5 5 m g) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査を

クロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 108 mg、収率 68% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.29 (s, 3H), 4.07 (s, 3H), 4.09 (s, 3H), 6.54 (br s, 1H), 7.13–7.29 (m, 8H), 7.59–7.60 (m, 3H), 8.49 (d, $J=5.9$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 447 (M^++1)

実施例 215 : プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリン)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (138 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 1-プロパノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 120 mg、収率 87% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , 400 MHz) : δ 0.95 (t, $J=7.6$ Hz, 3H), 1.63–1.66 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 4.04 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 4.05 (s, 6H), 6.67 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.15 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 7.37 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 8.77 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 9.06 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 411 (M^++1)

実施例 216 : フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩

化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にフェノール (48 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を97 mg、収率63%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400 MHz) : δ 4.03 (s, 3H), 4.04 (s, 3H), 6.83 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.24-7.30 (m, 3H), 7.38-7.47 (m, 3H), 7.57 (s, 1H), 7.72-7.74 (m, 3H), 8.79 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 10.50 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 417 ($M^+ + 1$)

実施例 217 : フェニルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (139 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にフェノール (44 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を73 mg、収率49%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6 , 400 MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.05 (s, 6H), 6.69 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.15-7.28 (m, 4H), 7.42-7.48 (m, 3H), 7.61 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 8.76 (d, $J=6.3$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 445 ($M^+ + 1$)

実施例 218 : ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジ

メチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にフェニルメタノール (51 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を137 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.24 (s, 2H), 6.52 (s, 1H), 6.59 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.26-7.45 (m, 5H), 7.64 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.51 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 459 ($M^+ + 1$)

実施例 219 : ベンジルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にフェニルメタノール (51 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を120 mg、収率78%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.24 (s, 2H), 6.55 (s, 2H), 7.03 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.37-7.43 (m, 5H), 7.67 (s, 1H), 7.76 (brs,

1 H), 8.15 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 459 (M⁺+1)

実施例 220 : ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にフェニルメタノール (55 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を100 mg、収率58%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 5.23 (s, 2H), 6.96 (s, 1H), 7.19 (d, J=9.0 Hz, 2H), 7.35-7.43 (m, 5H), 7.59 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.61 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 432 (M⁺+1)

実施例 221 : シクロヘキシルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (47 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を80 mg、収率53%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 1.49-1.57 (m, 1

0 H), 1.76–1.80 (m, 2H), 1.97–2.01 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.39 (s, 1H), 6.59 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 451 (M^++1)

実施例 222 : シクロヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (47 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を85 mg、収率56%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.47–2.20 (m, 13H), 2.28 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.74 (brs, 1H), 6.43 (s, 1H), 6.57 (brs, 1H), 7.02 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.75 (brs, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 451 (M^++1)

実施例 223 : 2-メチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にo-クレゾール (55 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽

和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 116 mg、収率 80% で得た。

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 432 ($M^+ + 1$)

実施例 224 : フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にフェノール (44 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 69 mg、収率 50% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.15 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 4.01 (s, 3H), 4.07 (s, 3H), 6.32 (d, $J=5.4$ Hz, 1H), 6.77 (brs, 1H), 6.97 (s, 1H), 7.22-7.28 (m, 3H), 7.40-7.47 (m, 3H), 7.60 (s, 1H), 7.85 (brs, 1H), 8.46 (d, $J=5.4$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 445 ($M^+ + 1$)

実施例 225 : ベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (134 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にフェニルメタノール (49 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、

濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を100mg、収率72%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 4.00 (s, 6H), 5.17 (s, 2H), 7.12-7.37 (m, 9H), 7.44 (s, 1H), 8.24 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 8.56 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 467 (M^++1)

実施例226 : 3-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100mg) をトルエン (10ml)、トリエチルアミン (1ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-メトキシフェニル)メタノール (71mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を133mg、収率79%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 3.83 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.58 (brs, 1H), 6.88-7.01 (m, 4H), 7.18 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 7.29-7.33 (m, 1H), 7.61-7.63 (m, 3H), 8.14 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 462 (M^++1)

実施例227 : 2-クロロベンジルN-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100mg) をトルエン (10ml)、トリエチルアミン (1ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-クロロフェニル)メタノール (73mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、

1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を153mg、収率90%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 4.03 (s, 3H), 4.04 (s, 3H), 5.27 (s, 2H), 6.83 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 7.35 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.41-7.43 (m, 2H), 7.52-7.54 (m, 1H), 7.58-7.61 (m, 2H), 7.69 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.74 (s, 1H), 8.77 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 10.12 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 466 (M^++1)

実施例228 : 3-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100mg) をトルエン (10ml)、トリエチルアミン (1ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-クロロフェニル)メタノール (73mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を158mg、収率93%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 4.03 (s, 3H), 4.04 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.82 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 7.35 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.42-7.47 (m, 3H), 7.52 (s, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.69 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.74 (s, 1H), 8.78 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 10.09 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 466 (M^++1)

実施例229 : 4-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(4-クロロフェニル)メタノール (73 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を147 mg、収率86%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 4.03 (s, 3H), 4.04 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.82 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.35 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.48 (s, 4H), 7.64 (s, 1H), 7.68 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.74 (s, 1H), 8.78 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 10.07 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 466 (M^++1)

実施例230 : シクロヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (51 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を120 mg、収率77%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.24-1.58 (m, 6H), 1.73-1.76 (m, 2H), 1.90-1.94 (m, 2H), 4.02 (s, 3H), 4.04 (s, 3H), 4.54 (br s, 1H), 6.79 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.32 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.67 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.72 (s, 1

H), 8.76 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 9.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 423 (M^++1)

実施例 231: ベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にフェニルメタノール (55 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を130 mg、収率82%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz): δ 4.03 (s, 3H), 4.04 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.82 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.30-7.46 (m, 7H), 7.62 (s, 1H), 7.69 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.74 (s, 1H), 8.78 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 10.04 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 431 (M^++1)

実施例 232: 2-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メチルフェニル)メタノール (57 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を140 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz): δ 2.07 (s, 3H), 2.

2.0 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.05 (s, 6H), 5.17 (s, 2H), 6.67 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.13–7.27 (m, 4H), 7.39 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 8.76 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 9.22 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 473 ($M^+ + 1$)

実施例 233 : 3-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-メチルフェニル)メタノール (57 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を140 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.07 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.05 (s, 6H), 5.12 (s, 2H), 6.65 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 7.12–7.31 (m, 5H), 7.39 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.75 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 9.21 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 473 ($M^+ + 1$)

実施例 234 : 4-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(4-メチルフェニル)メタノール (57 mg) を加えて、

さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を40mg、収率25%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 2.07 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 4.04 (s, 6H), 5.11 (s, 2H), 6.65 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 7.14-7.22 (m, 3H), 7.32 (d, $J=8.1\text{ Hz}$, 2H), 7.38 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.75 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 9.19 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 473 (M^++1)

実施例 235 : 2-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100mg) をトルエン (10ml)、トリエチルアミン (1ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-クロロフェニル)メタノール (67mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を127mg、収率77%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.36 (s, 2H), 6.55-6.56 (m, 2H), 7.03 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 1H), 7.25-7.33 (m, 1H), 7.43-7.50 (m, 2H), 7.67 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 494 (M^++1)

実施例 236 : 3-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-クロロフェニル)メタノール (67 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を147 mg、収率90%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.56 (d, $J=6.3$ Hz, 2H), 7.03 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.25-7.35 (m, 3H), 7.43 (s, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.75 (brs, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 494 (M^++1)

実施例 237 : 4-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(4-クロロフェニル)メタノール (67 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を103 mg、収率63%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.54 (brs, 2H), 7.03 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.38 (s, 4H), 7.66 (s, 1H), 7.71 (brs, 1

H), 8.15 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 494 ($M^+ + 1$)

実施例 238 : 3-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-メトキシフェニル)メタノール (65 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を136 mg、収率84%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.18 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.55 (brs, 2H), 6.84-7.02 (m, 4H), 7.25-7.32 (m, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.83 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.44 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 489 ($M^+ + 1$)

実施例 239 : 2-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メトキシフェニル)メタノール (65 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を130 mg、収率80%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.31 (s, 2H), 6.51 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 6.88–7.01 (m, 3H), 7.34–7.42 (m, 2H), 7.64 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 489 (M^++1)

実施例 240 : 3-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-メトキシフェニル)メタノール (65 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を120 mg、収率74%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 6.51 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.91–7.03 (m, 4H), 7.25–7.35 (m, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 489 (M^++1)

実施例 241 : 2-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10

分間加熱還流した。次に(2-クロロフェニル)メタノール (67 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を112 mg、収率68%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.36 (s, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.26-7.33 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.64 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 494 (M^++1)

実施例 242 : 3-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-クロロフェニル)メタノール (67 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を117 mg、収率71%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.14 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.26-7.38 (m, 3H), 7.44 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.43 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 494 (M^++1)

実施例 2 4 3 : 4-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (1 0 0 m g) をトルエン (1 0 m l) 、トリエチルアミン (1 m l) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (1 4 0 m g) を加えて 1 0 分間加熱還流した。次に(4-クロロフェニル)メタノール (6 7 m g) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 1 5 4 m g 、収率 9 4 % で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 4 0 0 M H z) : δ 2 . 1 3 (s , 3 H) , 2 . 2 7 (s , 3 H) , 4 . 1 1 (s , 3 H) , 4 . 1 7 (s , 3 H) , 5 . 2 0 (s , 2 H) , 6 . 5 0 (s , 1 H) , 6 . 5 8 (s , 1 H) , 6 . 9 5 (s , 1 H) , 7 . 3 8 (s , 4 H) , 7 . 6 4 (s , 1 H) , 7 . 9 0 (s , 1 H) , 8 . 1 5 (s , 1 H) , 8 . 4 7 (b r s , 1 H)

質量分析値 (E S I - M S , m / z) : 4 9 4 ($\text{M}^+ + 1$)

実施例 2 4 4 : プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (1 0 0 m g) をトルエン (1 0 m l) 、トリエチルアミン (1 m l) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (1 4 0 m g) を加えて 1 0 分間加熱還流した。次に1-プロパノール (2 8 m g) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 1 1 5 m g 、収率 8 3 % で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 4 0 0 M H z) : δ 1 . 0 1 (t , $J = 7 . 3 \text{ H z}$, 3 H) , 1 . 7 2 - 1 . 7 7 (m , 2 H) , 2 . 1 3 (s , 3 H) , 2 . 2 9 (s , 3 H) , 4 . 1 1 (s , 3 H) , 4 . 1 7 (s , 3 H) , 4 . 1 7 (t ,

$J = 7.8 \text{ Hz}$, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.60 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 411 ($M^+ + 1$)

実施例 245: 2-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メチルフェニル)メタノール (57 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を140 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz): δ 2.13 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.27 (s, 2H), 6.50 (s, 1H), 6.58 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.25-7.30 (m, 3H), 7.40 (d, $J = 7.1 \text{ Hz}$, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 473 ($M^+ + 1$)

実施例 246: 2-ナフチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-ナフチルメタノール (87 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、

濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 160 mg、収率 90% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.14 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.29 (s, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.58 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.37-7.53 (m, 4H), 7.59-7.65 (m, 4H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 510 ($M^+ + 1$)

実施例 247 : プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 104 mg、収率 73% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.01 (t, $J=7.6$ Hz, 3H), 1.71-1.76 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.17 (t, $J=8.1$ Hz, 2H), 6.69 (brs, 1H), 6.81 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 383 ($M^+ + 1$)

実施例 248 : 2-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩

化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メトキシフェニル)メタノール (71 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を123 mg、収率73%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 3.89 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.30 (s, 2H), 6.69 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.93–7.00 (m, 2H), 7.18–7.52 (m, 4H), 7.59–7.63 (m, 3H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 462 ($M^+ + 1$)

実施例 249 : 4-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(4-メトキシフェニル)メタノール (71 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を140 mg、収率83%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 3.83 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 6.68 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.92 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.17 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.37 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.63 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.49 (t, $J=6.6$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 462 ($M^+ + 1$)

実施例 250 : 2-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メチルフェニル)メタノール (62 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を143 mg、収率88%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.42 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.27 (s, 2H), 6.68 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.17-7.28 (m, 5H), 7.38 (d, $J=7.1\text{ Hz}$, 1H), 7.61 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.63 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.49 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 446 (M^++1)

実施例 251 : 3-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(3-メチルフェニル)メタノール (62 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を146 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.38 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.69

(b r s, 1 H), 6.92 (s, 1 H), 7.17–7.31 (m, 6 H), 7.61–7.63 (m, 3 H), 8.14 (s, 1 H), 8.51 (b r s, 1 H)

質量分析値 (E S I – M S, m/z) : 446 ($M^+ + 1$)

実施例 252 : 4-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(4-メチルフェニル)メタノール (62 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム–メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を133 mg、収率81%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.37 (s, 3 H), 4.10 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 5.20 (s, 2 H), 6.69 (b r s, 1 H), 6.92 (s, 1 H), 7.16–7.33 (m, 6 H), 7.60 (d, $J=7.3\text{ Hz}$, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.49 (b r s, 1 H)

質量分析値 (E S I – M S, m/z) : 446 ($M^+ + 1$)

実施例 253 : 2-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メチルフェニル)メタノール (57 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム–メタノール系のカラムで精製すること

により、表題の化合物を 122 mg、収率 77% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.26 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.27 (s, 2H), 6.52 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.24–7.30 (m, 3H), 7.40 (d, $J=7.1\text{ Hz}$, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 (M^++1)

実施例 254 : 3-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に(3-メチルフェニル)メタノール (57 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム–メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 120 mg、収率 76% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.58 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.18–7.30 (m, 4H), 7.64 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 (M^++1)

実施例 255 : 4-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して

溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン（140mg）を加えて10分間加熱還流した。次に(4-メチルフェニル)メタノール（57mg）を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を139mg、収率88%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.49 (s, 1H), 6.58 (br s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.22 (d, $J=7.8\text{Hz}$, 2H), 7.34 (d, $J=8.1\text{Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.50 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 (M^++1)

実施例256 : ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン（100mg）をトルエン（10ml）、トリエチルアミン（1ml）に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン（151mg）を加えて10分間加熱還流した。次に1-ヘキサノール（52mg）を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を110mg、収率70%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 0.92 (t, $J=6.8\text{Hz}$, 3H), 1.33-1.35 (m, 6H), 1.67-1.72 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.20 (t, $J=6.8\text{Hz}$, 2H), 6.70 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 1H), 6.79 (s, 1H), 7.18 (d, $J=9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.51 (br s, 1

H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 426 ($M^+ + 1$)

実施例 257 : 4-ブチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ブチルフェノール (77 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を130 mg、収率75%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.94 (t, $J=7.3$ Hz, 3H), 1.34-1.40 (m, 2H), 1.51-1.63 (m, 2H), 2.63 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.71 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.09 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.20-7.23 (m, 4H), 7.64 (s, 1H), 7.69 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 8.15 (s, 1H), 8.52 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 ($M^+ + 1$)

実施例 258 : 1-エチルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘキサノール (52 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を130

mg、収率83%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 0.95–0.98 (m, 6H), 1.39–1.67 (m, 6H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.84–4.86 (m, 1H), 6.70 (d, $J=6.1\text{ Hz}$, 1H), 6.77 (s, 1H), 7.18 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.61 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.53 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 426 (M^++1)

実施例259 : 4-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100mg) をトルエン (10ml)、トリエチルアミン (1ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (151mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-(tert-ブチル)フェノール (77mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム–メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を150mg、収率87%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 1.34 (s, 9H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.71 (d, $J=6.1\text{ Hz}$, 1H), 7.13 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.21–7.27 (m, 3H), 7.43 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 7.68 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 8.15 (s, 1H), 8.51 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 (M^++1)

実施例260 : 2-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (100mg) をトルエン (10ml)、トリエチルアミン (1ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩

化メチレンに溶解したトリホスゲン (151 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メトキシフェノール (63 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を75 mg、収率46%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 3.90 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.70 (br s, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.92-7.02 (m, 4H), 7.15-7.25 (m, 3H), 7.64 (s, 1H), 7.70 (d, $J=8.3$ Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.52 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 448 (M^++1)

実施例 261 : ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ヘキサノール (48 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を106 mg、収率72%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.92 (t, $J=7.1$ Hz, 3H), 1.34-1.44 (m, 6H), 1.67-1.74 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.20 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.75 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.46 (t, $J=6.3$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 454 ($M^+ + 1$)

実施例 262 : ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (100 mg) をトルエン (10 ml)、トリエチルアミン (1 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (140 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ヘキサノール (48 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を154 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.92 (t, $J=7.1$ Hz, 3H), 1.34-1.42 (m, 6H), 1.68-1.73 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.18 (s, 3H), 4.21 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.59 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 454 ($M^+ + 1$)

実施例 263 : 1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-フェニル-1-プロパノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を77 mg、収率92%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.96 (t, $J=7.6$ Hz, 3H), 1.88–1.93 (m, 1H), 1.99–2.05 (m, 1H), 4.10 (s, 3H), 4.16 (s, 3H), 5.69 (t, $J=7.3$ Hz, 1H), 6.66 (d, $J=5.6$ Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.16 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.32–7.39 (m, 5H), 7.59 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.63 (s, 1H), 8.15 (d, $J=4.1$ Hz, 1H), 8.45–8.47 (m, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 460 (M^++1)

実施例 264 : 1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-フェニル-1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を76 mg、収率97%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.97 (t, $J=7.5$ Hz, 3H), 1.89–1.94 (m, 1H), 2.01–2.17 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.68 (t, $J=7.3$ Hz, 1H), 6.50 (s, 1H), 6.55 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.33–7.39 (m, 5H), 7.64 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.45 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 488 (M^++1)

実施例 265 : 1-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg)

をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-フェニル-1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を52 mg、収率66%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.96 (t, $J=7.3$ Hz, 3H), 1.89–1.92 (m, 1H), 1.94–2.05 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.69 (t, $J=7.1$ Hz, 1H), 6.52 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.99 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.32–7.39 (m, 5H), 7.66 (s, 1H), 7.73 (brs, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.45 (t, $J=6.6$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 488 (M^++1)

実施例 266 : 4-ペンテニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ペンテン-1-オール (22 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を77 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.80–1.83 (m, 2H), 2.16–2.20 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.23 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 5.02–5.10 (m, 2H), 5.83–5.85 (m, 1H), 6.69 (d, $J=6.3$ Hz, 1

H), 6.76 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 410 (M^++1)

実施例 267: 4-ペンテニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ペンテン-1-オール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を71 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz): δ 1.81–1.85 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.18–2.20 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.23 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 5.02–5.11 (m, 2H), 5.81–5.88 (m, 1H), 6.42 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 438 (M^++1)

実施例 268: 4-ペンテニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ペンテン-1-オール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、

1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を67mg、収率95%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 1.79–1.86 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.16–2.20 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.22 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 5.02–5.10 (m, 2H), 5.81–5.88 (m, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.76 (brs, 1H), 8.16 (d, $J=4.1$ Hz, 1H), 8.45 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 438 (M^++1)

実施例 269 : 2,6-ジメチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2,6-ジメチルフェノール (32mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を82mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 2.26 (s, 6H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.70 (d, $J=7.6$ Hz, 1H), 7.10 (s, 2H), 7.22–7.26 (m, 4H), 7.65 (s, 1H), 7.71 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 8.16 (d, $J=4.1$ Hz, 1H), 8.48 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 446 (M^++1)

実施例 270 : 2,6-ジメチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2,6-ジメチルフェノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を76 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3 H) , 2.28 (s, 6 H) , 2.39 (s, 3 H) , 4.11 (s, 3 H) , 4.17 (s, 3 H) , 6.59 (d, $J=5.9\text{ Hz}$, 1 H) , 7.01 (s, 1 H) , 7.11 (s, 2 H) , 7.25-7.27 (m, 2 H) , 7.65 (s, 1 H) , 7.98 (b r s, 1 H) , 8.16 (s, 1 H) , 8.47 (b r s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 ($M^+ + 1$)

実施例 271 : 2,6-ジメチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2,6-ジメチルフェノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を68 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.14 (s, 3 H) , 2.28 (s, 6 H) , 2.38 (s, 3 H) , 4.12 (s, 3 H) , 4.18 (s, 3 H) , 6.56 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 1 H) , 7.00-7.10 (m, 4 H) , 7.25-7.27 (m, 1 H) , 7.67 (s, 1 H) , 8.

1.6 (s, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 (M⁺+1)

実施例 272 : 4-ブチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ブチルフェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を12 mg、収率15%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 0.90-0.96 (m, 3H), 1.33-1.44 (m, 2H), 1.50-1.65 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.53 (t, J=7.8 Hz, 1H), 2.63 (t, J=8.1 Hz, 1H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.44 (s, 1H), 6.58 (d, J=6.3 Hz, 1H), 6.75 (d, J=8.5 Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.02 (t, J=8.5 Hz, 1H), 7.11 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.22 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.89 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.45 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 502 (M⁺+1)

実施例 273 : 4-ブチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ブチルフェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、

1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を44mg、収率55%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 0.94 (t, $J=7.3\text{ Hz}$, 3H), 1.34-1.44 (m, 2H), 1.56-1.63 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.63 (t, $J=7.8\text{ Hz}$, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.57 (d, $J=10.7\text{ Hz}$, 1H), 7.04-7.26 (m, 6H), 7.67 (s, 1H), 7.84 (brs, 1H), 8.17 (d, $J=4.4\text{ Hz}$, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 502 (M^++1)

実施例 274 : 4-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-(tert-ブチル)フェノール (35mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を35mg、収率44%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 1.54 (s, 9H), 2.13 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.59 (s, 1H), 6.77 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 7.14 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.43 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.65 (s, 1H), 7.99 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 502 (M^++1)

実施例 275 : 4-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)

ル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-(tert-ブチル)フェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を34 mg、収率42%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.54 (s, 9H), 2.13 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.57 (d, $J=5.6$ Hz, 1H), 6.77 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.05 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 7.14 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.42 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.67 (s, 1H), 7.84 (brs, 1H), 8.17 (d, $J=3.9$ Hz, 1H), 8.45 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 502 (M^++1)

実施例 276 : 1-エチルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘキサノール (24 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を20 mg、収率27%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.95-0.99 (m, 6H), 1.40-1.65 (m, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s,

3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.85 (br s, 1 H), 6.41 (s, 1 H), 6.57 (d, J=4.6 Hz, 1 H), 6.94 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.96 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.45 (br s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 454 ($M^+ + 1$)

実施例 277 : 1-エチルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘキサノール (24 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を39 mg、収率53%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - d_1 , 400 MHz) : δ 0.94-0.99 (m, 6 H), 1.40-1.68 (m, 6 H), 2.10 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.12 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.85 (br s, 1 H), 6.55 (d, J=5.9 Hz, 1 H), 7.00-7.03 (m, 1 H), 7.79 (s, 1 H), 8.16-8.17 (m, 1 H), 8.44 (br s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 454 ($M^+ + 1$)

実施例 278 : 2-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メトキシフェノール (29 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、

1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を39mg、収率51%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.12 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.60 (d, $J=5.9\text{ Hz}$, 1H), 6.86-7.04 (m, 4H), 7.17-7.19 (m, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 8.16 (d, $J=4.1\text{ Hz}$, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 476 (M^++1)

実施例 279 : 2-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メトキシフェノール (29mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を31mg、収率41%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.57 (brs, 1H), 6.86-7.06 (m, 5H), 7.18 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 7.67 (d, $J=2.0\text{ Hz}$, 1H), 8.17 (d, $J=3.9\text{ Hz}$, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 476 (M^++1)

実施例 280 : 2,6-ジメトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン

(5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2,6-ジメトキシフェノール (40 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を80 mg、収率92%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 3.87 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.60–6.67 (m, 4H), 7.17–7.21 (m, 2H), 7.64 (s, 1H), 7.70 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 478 (M^++1)

実施例 281 : 2,6-ジメトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2,6-ジメトキシフェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を75 mg、収率93%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 2.33 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.89 (s, 6H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.60 (br s, 1H), 6.67 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 6.98–7.19 (m, 2H), 7.65 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 506 (M^++1)

実施例 282 : 2,6-ジメトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)

オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2,6-ジメトキシフェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を74 mg、収率91%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.21 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.58–6.60 (m, 2H), 6.66 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 6.78–6.82 (m, 1H), 7.02–7.05 (m, 1H), 7.16–7.20 (m, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.47 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 506 (M^++1)

実施例283 : シクロヘキシルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘキシルメタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を49 mg、収率61%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.03–1.04 (m, 2H), 1.21–1.27 (m, 4H), 1.78–1.80 (m, 5H), 4.

0.2 (d, $J=6.3$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.70 (d, $J=5.9$ Hz, 1H), 6.88 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (d, $J=4.1$ Hz, 1H), 8.47 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 438 (M^++1)

実施例 284: シクロヘキシルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘキシルメタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率83%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz): δ 1.02–1.04 (m, 2H), 1.21–1.31 (m, 4H), 1.72–1.79 (m, 5H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.03 (d, $J=6.3$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 6.58 (d, $J=4.9$ Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.16 (d, $J=4.1$ Hz, 1H), 8.46 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 466 (M^++1)

実施例 285: シクロヘキシルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間

加熱還流した。次にシクロヘキシルメタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を48 mg、収率64%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - d_1 , 400 MHz) : δ 0.97-1.07 (m, 2 H), 1.17-1.32 (m, 4 H), 1.69-1.82 (m, 5 H), 2.10 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.02 (d, $J=6.6$ Hz, 2 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.44 (s, 1 H), 6.55 (d, $J=5.4$ Hz, 1 H), 7.00-7.04 (m, 2 H), 7.67 (s, 1 H), 7.77 (brs, 1 H), 8.16 (d, $J=4.1$ Hz, 1 H), 8.44 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 466 ($M^+ + 1$)

実施例 286 : シクロヘプチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘプタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を68 mg、収率85%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - d_1 , 400 MHz) : δ 1.47-1.79 (m, 12 H), 4.10 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.90-4.96 (m, 1 H), 6.70 (d, $J=5.9$ Hz, 1 H), 6.83 (s, 1 H), 7.17 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.60 (d, $J=8.5$ Hz, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.47 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 438 ($M^+ + 1$)

実施例 287 : シクロヘプチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘプタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を68 mg、収率91%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.51–1.74 (m, 12 H), 2.13 (s, 3 H), 2.29 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.96 (br s, 1 H), 6.40 (s, 1 H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1 H), 6.94 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.95 (s, 1 H), 8.16 (d, $J=4.1$ Hz, 1 H), 8.46 (br s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 466 ($M^+ + 1$)

実施例 288 : シクロヘプチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘプタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を66 mg、収率88%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.51–1.74 (m, 1

2 H), 2.10 (s, 3 H), 2.27 (s, 3 H), 4.12 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.96 (brs, 1 H), 6.43 (s, 1 H), 6.56 (d, $J=6.6$ Hz, 1 H), 7.02 (d, $J=9.3$ Hz, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.78 (s, 1 H), 8.16 (d, $J=3.9$ Hz, 1 H), 8.45 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 466 (M^++1)

実施例 289 : 2-メチルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にo-クレゾール (25 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率84%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3 H), 2.31 (s, 3 H), 2.39 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.60 (d, $J=6.3$ Hz, 1 H), 6.85 (s, 1 H), 7.00 (s, 1 H), 7.14-7.27 (m, 4 H), 7.65 (s, 1 H), 7.98 (brs, 1 H), 8.15 (d, $J=3.7$ Hz, 1 H), 8.52 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 460 (M^++1)

実施例 290 : 3-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-メトキシフェノール (29 mg) を加えて、さらに加熱還

流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を30mg、収率39%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.14 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.42 (s, 1H), 6.59 (brs, 1H), 6.79–6.84 (m, 3H), 7.00 (s, 1H), 7.30–7.34 (m, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.98 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 476 ($M^+ + 1$)

実施例 291 : 3-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-メトキシフェノール (29mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を23mg、収率30%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.44–6.48 (m, 1H), 6.56–6.58 (m, 1H), 6.78–6.83 (m, 3H), 7.06 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 7.29–7.33 (m, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.81 (brs, 1H), 8.16 (d, $J=3.4\text{ Hz}$, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 476 ($M^+ + 1$)

実施例 292 : 1,2,3,4-テトラヒドロ-2-ナフタレニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1,2,3,4-テトラヒドロ-2-ナフタレノール (34 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を80 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.08–2.13 (m, 2 H) , 2.12 (s, 3 H) , 2.27 (s, 3 H) , 2.80–3.24 (m, 4 H) , 4.11 (s, 3 H) , 4.17 (s, 3 H) , 5.30 (brs, 1 H) , 6.43 (s, 1 H) , 6.57 (d, $J=6.6$ Hz, 1 H) , 6.94 (s, 1 H) , 7.11–7.18 (m, 4 H) , 7.64 (s, 1 H) , 7.94 (brs, 1 H) , 8.15 (d, $J=3.9$ Hz, 1 H) , 8.48 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 500 ($M^+ + 1$)

実施例 293 : 1,2,3,4-テトラヒドロ-2-ナフタレニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1,2,3,4-テトラヒドロ-2-ナフタレノール (34 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を55 mg、収率69%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.08–2.13 (m, 2

H), 2.09 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.92–3.23 (m, 4H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.29 (brs, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.55 (d, $J=6.1$ Hz, 1H), 7.01 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.12–7.18 (m, 4H), 7.67 (s, 1H), 7.77 (brs, 1H), 8.16 (d, $J=3.7$ Hz, 1H), 8.48 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 500 (M^++1)

実施例 294 : 4-フェニルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 4-フェニルフェノール (44 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 29 mg、収率 32% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 6.93 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.26–7.78 (m, 13H), 8.14 (brs, 1H), 8.53 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 494 (M^++1)

実施例 295 : 4-フェニルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 4-フェニルフェノール (39 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、

1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を55mg、収率66%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.14 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.44 (s, 1H), 6.60 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.01 (brs, 1H), 7.26-7.52 (m, 4H), 7.57-7.65 (m, 5H), 7.89 (s, 1H), 8.15 (brs, 1H), 8.48 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 522 ($M^+ + 1$)

実施例296 : 4-フェニルフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-フェニルフェノール (39mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を36mg、収率43%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 2.14 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.57-6.59 (m, 1H), 6.92-7.08 (m, 2H), 7.25-7.79 (m, 10H), 8.16-8.17 (m, 1H), 8.47-8.52 (m, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 522 ($M^+ + 1$)

実施例297 : フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン

(5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-フェニル-1-エタノール (32 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を42 mg、収率51%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 3.03 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.45 (t, $J=7.1$ Hz, 2H), 6.69 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 7.16–7.36 (m, 7H), 7.52–7.64 (m, 3H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 446 (M^++1)

実施例 298 : フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-フェニル-1-エタノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を76 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.12 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 3.04 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.44 (t, $J=7.1$ Hz, 2H), 6.40 (s, 1H), 6.59 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.26–7.36 (m, 5H), 7.64 (s, 1H), 7.86 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 ($M^+ + 1$)

実施例 299 : フェネチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-フェニル-1-エタノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を60 mg、収率79%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3 - d_1$, 400 MHz) : δ 2.09 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 3.03 (t, $J = 6.8 \text{ Hz}$, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.44 (t, $J = 7.1 \text{ Hz}$, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.55 (d, $J = 5.9 \text{ Hz}$, 1H), 7.01 (d, $J = 8.5 \text{ Hz}$, 1H), 7.26–7.36 (m, 5H), 7.66 (s, 1H), 8.16 (d, $J = 4.1 \text{ Hz}$, 1H), 8.46 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 ($M^+ + 1$)

実施例 300 : 2-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-(tert-ブチル)フェノール (39 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を64 mg、収率74%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3 - d_1$, 400 MHz) : δ 1.42 (s, 9H), 4.

1.1 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.72 (brs, 1H), 7.11 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.22–7.26 (m, 6H), 7.43–7.45 (m, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.71 (brs, 1H), 8.15 (brs, 1H), 8.51 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 474 ($M^+ + 1$)

実施例 301 : 2-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-(tert-ブチル)フェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム–メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を77 mg、収率96%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.56 (s, 9H), 2.13 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.59 (brs, 1H), 7.01 (s, 1H), 7.13 (d, $J=7.8$ Hz, 1H), 7.21–7.26 (m, 3H), 7.43–7.45 (m, 1H), 7.65 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 502 ($M^+ + 1$)

実施例 302 : 2-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-(tert-ブチル)フェノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽

出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を48mg、収率60%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.56 (s, 9H), 2.14 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.18 (s, 3H), 6.55 (brs, 1H), 7.06 (d, $J=9.0\text{Hz}$, 1H), 7.14 (d, $J=7.8\text{Hz}$, 1H), 7.21-7.26 (m, 4H), 7.42 (brs, 1H), 7.67 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.48 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 502 (M^++1)

実施例303 : 2-ピペリジノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-ピペリジノ-1-エタノール (34mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を66mg、収率74%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.89-1.93 (m, 4H), 2.29-2.45 (m, 2H), 2.74-2.86 (m, 2H), 3.36 (brs, 1H), 3.70-3.73 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.16 (s, 3H), 4.56-4.58 (m, 2H), 6.72 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 1H), 7.15 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 2H), 7.65 (s, 1H), 7.74 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 2H), 8.10 (s, 1H), 8.52 (t, $J=6.3\text{Hz}$, 1H), 9.60 (brs, 1H), 11.42 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 453 (M^++1)

実施例 304 : 2-ピペリジノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-ピペリジノ-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を42 mg、収率51%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.50 (brs, 2H) , 1.85 (brs, 2H) , 2.11 (s, 3H) , 2.43 (brs, 5H) , 2.78 (brs, 2H) , 3.34 (brs, 2H) , 3.70 (brs, 2H) , 4.11 (s, 3H) , 4.17 (s, 3H) , 4.56 (brs, 2H) , 6.61 (brs, 1H) , 6.95 (s, 1H) , 7.66 (s, 1H) , 7.86 (s, 1H) , 8.13 (s, 1H) , 8.48 (brs, 1H) 11.85 (brs, 1H) ,

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 481 ($M^+ + 1$)

実施例 305 : 2-ピペリジノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-ピペリジノ-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を83 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.88 (brs, 2H) ,

2.09 (s, 3H), 2.31–2.39 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.47–2.51 (m, 1H), 2.71–2.80 (m, 2H), 3.12–3.14 (m, 1H), 3.33 (brs, 2H), 3.69 (brs, 2H), 4.01–4.03 (m, 1H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.54–4.55 (m, 2H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.98 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.76 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.48–8.49 (m, 1H), 11.83 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 481 (M^++1)

実施例306: 2-モルホリノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-モルホリノ-1-エタノール (34 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を43 mg、収率48%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz): δ 3.11 (brs, 2H), 3.42 (brs, 2H), 3.66 (brs, 2H), 4.01–4.19 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.16 (s, 3H), 4.46 (brs, 2H), 4.62 (brs, 2H), 6.73 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.73 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.54 (brs, 1H), 9.45 (s, 1H), 12.38 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 455 (M^++1)

実施例307: 2-モルホリノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-モルホリノ-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を63 mg、収率76%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.11 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 3.06 (brs, 2H), 3.41 (brs, 2H), 3.62 (brs, 2H), 4.02-4.17 (m, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.52-4.59 (m, 4H), 6.60 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.13 (s, 2H), 8.30 (brs, 1H), 8.50 (brs, 1H), 12.79 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 483 ($M^+ + 1$)

実施例308 : 2-モルホリノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-モルホリノ-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を74 mg、収率89%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.09 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.03 (brs, 2H), 3.38 (brs, 2H), 3.62 (d, $J=11.7\text{ Hz}$, 2H), 4.02-4.04 (m, 2H), 4.

1.2 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.50–4.59 (m, 4H), 6.57 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.99 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.77 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.32 (brs, 1H), 8.48 (s, 1H), 12.87 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 483 ($M^+ + 1$)

実施例 309 : 6-(ジメチルアミノ)ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に6-(ジメチルアミノ)-1-ヘキサノール (38 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を31 mg、収率34%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.43–1.87 (m, 8H), 2.82–3.08 (m, 8H), 4.11 (s, 3H), 4.16 (s, 3H), 4.11–4.22 (m, 2H), 6.72 (s, 1H), 7.14 (s, 2H), 7.65 (s, 1H), 7.87 (s, 2H), 8.11 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H), 8.80 (brs, 1H), 12.00 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 469 ($M^+ + 1$)

実施例 310 : 6-(ジメチルアミノ)ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に6-(ジメチルアミノ)-1-ヘキサノール (33 mg) を加えて、

さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を48mg、収率56%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 1.53–1.93 (m, 8H), 2.13 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.83 (s, 6H), 3.02 (brs, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.11–4.21 (m, 2H), 6.61 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.49 (brs, 1H), 12.39 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 497 ($M^+ + 1$)

実施例 311 : 6-(ジメチルアミノ)ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に6-(ジメチルアミノ)-1-ヘキサノール (33mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を66mg、収率77%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 1.75–2.01 (m, 8H), 2.10 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.83 (s, 6H), 3.03 (s, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.12–4.21 (m, 2H), 6.59 (s, 1H), 7.01 (d, $J=8.1$ Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H), 12.02 (brs, 1H), 12.30 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 497 ($M^+ + 1$)

実施例 312 : シクロヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキ

シ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を60 mg、収率71%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.21–1.57 (m, 6 H), 1.76 (brs, 2 H), 1.94 (brs, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 4.78 (brs, 1 H), 6.72 (s, 1 H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.57 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 425 ($M^+ + 1$)

実施例313 : シクロヘキシル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を61 mg、収率77%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.30–1.58 (m, 6 H), 1.78 (brs, 2 H), 1.95 (brs, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 4.79 (brs, 1 H), 7.16–7.20 (m, 2 H), 7.32 (s, 1 H), 7.59 (s, 1 H), 8.17 (s,

1 H), 8.40 (d, J=9.3 Hz, 1 H), 8.82 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 459 (M⁺+1)

実施例 314 : プロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-プロパノール (16 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を77 mg、収率100%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 1.00 (t, J=7.3 Hz, 3 H), 1.68-1.75 (m, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.16 (t, J=6.8 Hz, 2 H), 4.19 (s, 3 H), 6.77 (s, 1 H), 7.20 (d, J=9.0 Hz, 2 H), 7.58 (d, J=8.8 Hz, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.81 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 384 (M⁺+1)

実施例 315 : 2-メトキシベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メトキシフェニル)メタノール (36 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を91 mg、収率100%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 3.88 (s, 3 H), 4.

1.2 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 5.29 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.92–7.00 (m, 2H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.33–7.40 (m, 2H), 7.57 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 463 (M^++1)

実施例 316 : 2-メトキシベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メトキシフェニル)メタノール (32 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を79 mg、収率93%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - d_1 , 400 MHz) : δ 3.89 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 5.32 (s, 2H), 6.89 (s, 2H), 6.89–7.01 (m, 3H), 7.18–7.21 (m, 1H), 7.29–7.43 (m, 3H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.43 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 8.83 (s, 1H), 9.57 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 497 (M^++1)

実施例 317 : 2-クロロベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-クロロフェニル)メタノール (37 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、

1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を92mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 5.35 (s, 2H), 7.20 (d, $J=9.0\text{Hz}$, 2H), 7.29-7.32 (m, 2H), 7.42-7.44 (m, 1H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.59 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 467 (M^++1)

実施例318 : 2-クロロベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-クロロフェニル)メタノール (33mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を80mg、収率93%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 5.38 (s, 2H), 7.19-7.22 (m, 1H), 7.30-7.35 (m, 3H), 7.43-7.45 (m, 1H), 7.49-7.51 (m, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.41 (d, $J=9.0\text{Hz}$, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 501 (M^++1)

実施例319 : 2-メチルベンジル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、

塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メチルフェニル)メタノール (32 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を79 mg、収率90%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.41 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 5.26 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 7.20 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.22-7.30 (m, 3H), 7.37-7.39 (m, 1H), 7.58 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.61 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 447 ($M^+ + 1$)

実施例 320 : 2-メチルベンジル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に(2-メチルフェニル)メタノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率75%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.43 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 7.18-7.33 (m, 5H), 7.40 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.41 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 481 ($M^+ + 1$)

実施例 3 2 1 : ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}
カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (5 0 m g) をトルエン (5 m l) 、 トリエチルアミン (0 . 5 m l) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (7 7 m g) を加えて 1 0 分間加熱還流した。次に1-ブタノール (1 9 m g) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 3 4 m g 、収率 4 6 % で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 4 0 0 M H z) : δ 0 . 9 7 (t , $J = 7 . 3 \text{ Hz}$, 3 H) , 1 . 4 1 - 1 . 4 9 (m , 2 H) , 1 . 6 2 - 1 . 7 2 (m , 2 H) , 4 . 1 0 (s , 3 H) , 4 . 1 7 (s , 3 H) , 4 . 2 1 (t , $J = 6 . 8 \text{ Hz}$, 2 H) , 6 . 7 0 (d , $J = 6 . 3 \text{ Hz}$, 1 H) , 6 . 8 5 (s , 1 H) , 7 . 1 8 (d , $J = 8 . 8 \text{ Hz}$, 2 H) , 7 . 6 1 (d , $J = 8 . 8 \text{ Hz}$, 2 H) , 7 . 6 4 (s , 1 H) , 8 . 1 5 (s , 1 H) , 8 . 4 7 (b r s , 1 H)

質量分析値 (E S I - M S , m/z) : 3 9 7 ($M^+ + 1$)

実施例 3 2 2 : ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (5 0 m g) をトルエン (5 m l) 、 トリエチルアミン (0 . 5 m l) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (6 8 m g) を加えて 1 0 分間加熱還流した。次に1-ブタノール (1 7 m g) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 6 5 m g 、収率 9 4 % で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 4 0 0 M H z) : δ 0 . 9 9 (t , $J = 7 . 3 \text{ Hz}$, 3 H

z, 3 H), 1.41–1.50 (m, 2 H), 1.67–1.74 (m, 2 H), 2.13 (s, 3 H), 2.29 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.22 (t, J=6.8 Hz, 2 H), 6.42 (s, 1 H), 6.59 (brs, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 8.46 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 426 (M⁺+1)

実施例 323 : ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ブタノール (17 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を60 mg、収率87%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 0.98 (t, J=7.3 Hz, 3 H), 1.40–1.49 (m, 2 H), 1.67–1.73 (m, 2 H), 2.10 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.12 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.21 (t, J=6.8 Hz, 2 H), 6.46 (s, 1 H), 6.56 (d, J=6.3 Hz, 1 H), 7.02 (d, J=8.8 Hz, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.76 (d, J=8.5 Hz, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.47 (t, J=6.3 Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 426 (M⁺+1)

実施例 324 : イソプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、

塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-プロパノール (16 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を42 mg、収率59%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.33 (d, $J=6.3$ Hz, 6H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.02–5.09 (m, 1H), 6.70 (d, $J=6.1$ Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 7.18 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 7.60 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 383 (M^++1)

実施例325 : イソプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-プロパノール (14 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を50 mg、収率75%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.34 (d, $J=6.3$ Hz, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.04–5.07 (m, 1H), 6.38 (s, 1H), 6.58 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 412 ($M^+ + 1$)

実施例 326 : オクタデシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]}フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-オクタデカノール (70 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を54 mg、収率51%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.88 (t, $J=7.1$ Hz, 3H), 1.20-1.45 (m, 30H), 1.68-1.72 (m, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.20 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 6.69 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.77 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 594 ($M^+ + 1$)

実施例 327 : オクタデシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-オクタデカノール (62 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を83 mg、収率84%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.88 (t, $J=7.1$ Hz, 3H), 1.26–1.42 (m, 30H), 1.67–1.73 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.20 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.59 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 622 (M^++1)

実施例 328 : オクタデシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-オクタデカノール (62 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を96 mg、収率97%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.88 (t, $J=6.8$ Hz, 3H), 1.21–1.42 (m, 30H), 1.67–1.72 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.20 (t, $J=6.8$ Hz, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.75 (brs, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 622 (M^++1)

実施例 329 : 1-エチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン

(5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘプタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を46 mg、収率57%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.90–0.98 (m, 6 H), 1.35–1.36 (m, 4 H), 1.62–1.69 (m, 4 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.80–4.86 (m, 1 H), 6.69 (d, $J=6.3$ Hz, 1 H), 6.79 (s, 1 H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H), 7.62 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.47 (t, $J=6.6$ Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 440 (M^++1)

実施例330 : 1-エチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘプタノール (27 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を59 mg、収率78%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.93–0.99 (m, 6 H), 1.30–1.45 (m, 4 H), 1.57–1.68 (m, 4 H), 2.13 (s, 3 H), 2.30 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.82–4.85 (m, 1 H), 6.42 (s, 1 H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1

H), 7.96 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 468 ($M^+ + 1$)

実施例 331 : 1-エチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘプタノール (27 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を46 mg、収率61%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.91-0.99 (m, 6H), 1.30-1.45 (m, 4H), 1.59-1.68 (m, 4H), 2.10 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.82-4.84 (m, 1H), 6.43 (s, 1H), 6.55 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 7.02 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.78 (brs, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (t, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 468 ($M^+ + 1$)

実施例 332 : 1-プロピルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ヘプタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロ

クロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 48 mg、収率 60% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.95 (t, $J=7.3$ Hz, 6H), 1.37–1.45 (m, 4H), 1.53–1.63 (m, 4H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.89–4.94 (m, 1H), 6.69 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 6.76 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (t, $J=6.1$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 440 (M^++1)

実施例 333 : 1-プロピルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 4-ヘプタノール (27 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 57 mg、収率 76% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.96 (t, $J=7.3$ Hz, 6H), 1.38–1.46 (m, 4H), 1.54–1.64 (m, 4H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.91–4.94 (m, 1H), 6.41 (s, 1H), 6.57 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.46 (t, $J=6.3$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 468 (M^++1)

実施例 334 : 1-プロピルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]

シ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ヘプタノール (27 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を44 mg、収率58%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.96 (t, $J=7.1$ Hz, 6H), 1.37–1.45 (m, 4H), 1.57–1.64 (m, 4H), 2.10 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.90–4.93 (m, 1H), 6.42 (s, 1H), 6.55 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.78 (brs, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.45 (t, $J=6.3$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 468 (M^++1)

実施例335 : ヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ヘキサノール (27 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を69 mg、収率82%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.91 (t, $J=7.1$ Hz, 3H), 1.31–1.49 (m, 6H), 1.66–1.73 (m, 2

H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.19 (t, J=7.1 Hz, 2H), 6.79 (s, 1H), 7.20 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.58 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 427 (M⁺+1)

実施例 336 : ヘキシル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ヘキサノール (24 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を54 mg、収率68%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 0.92 (t, J=7.1 Hz, 3H), 1.32-1.49 (m, 6H), 1.68-1.75 (m, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.22 (t, J=6.8 Hz, 2H), 7.18 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.21 (d, J=2.7 Hz, 1H), 7.33 (d, J=2.7 Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.39 (d, J=9.0 Hz, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 461 (M⁺+1)

実施例 337 : 1-エチルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘキサノール (27 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌

した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62mg、収率73%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 0.93-0.97 (m, 6H), 1.36-1.68 (m, 6H), 4.13 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.82-4.87 (m, 1H), 6.75 (s, 1H), 7.20 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 427 (M^++1)

実施例338 : 1-エチルブチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘキサノール (24mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を55mg、収率69%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400MHz) : δ 0.94-0.99 (m, 6H), 1.37-1.70 (m, 6H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.83-4.87 (m, 1H), 7.18 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 1H), 7.20 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 1H), 7.33 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.42 (d, $J=9.3\text{ Hz}$, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 461 (M^++1)

実施例339 : フェネチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-フェニル-1-エタノール (28 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を18 mg、収率22%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 3.03 (t, $J=7.1$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.45 (t, $J=7.1$ Hz, 2H), 7.17 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 7.20 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.29–7.34 (m, 6H), 7.58 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.33 (br s, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 481 ($M^+ + 1$)

実施例340 : シクロヘキシルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘキシルメタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を61 mg、収率70%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.00–1.06 (m, 2H), 1.17–1.29 (m, 3H), 1.69–1.79 (m, 6H), 4.01 (d, $J=6.3$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 6.80 (s, 1H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.5

8 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 439 (M^++1)

実施例 341 : シクロヘキシルメチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘキシルメタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を54 mg、収率66%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.01–1.07 (m, 2H), 1.18–1.31 (m, 3H), 1.70–1.82 (m, 6H), 4.04 (d, $J=6.3$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 7.18 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.21 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.33 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.39 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 473 (M^++1)

実施例 342 : シクロヘプチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘプタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査を

クロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 62 mg、収率 72% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.49–1.77 (m, 10H), 1.97–2.04 (m, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.92–4.99 (m, 1H), 6.74 (s, 1H), 7.19 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.57 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 439 (M^++1)

実施例 343 : シクロヘプチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 1-シクロヘプタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 60 mg、収率 73% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.42–1.79 (m, 10H), 1.80–2.04 (m, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.95–4.99 (m, 1H), 7.14–7.20 (m, 2H), 7.32 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.40 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 473 (M^++1)

実施例 344 : ブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、

塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ブタノール (19 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を46 mg、収率58%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.97 (t, $J=7.3$ Hz, 3H), 1.40–1.51 (m, 2H), 1.60–1.72 (m, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.19 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 6.77 (s, 1H), 7.20 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.58 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 398 (M^++1)

実施例345 : ブチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-ブタノール (17 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を50 mg、収率66%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.98 (t, $J=7.3$ Hz, 3H), 1.40–1.51 (m, 2H), 1.58–1.74 (m, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.23 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 7.19–7.25 (m, 2H), 7.33 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.39 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 433 ($M^+ + 1$)

実施例 346 : 1-フェニルプロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-フェニル-1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を43 mg、収率51%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.96 (t, $J=7.3$ Hz, 3H), 1.86–1.95 (m, 1H), 2.00–2.08 (m, 1H), 4.11 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 5.68 (t, $J=7.3$ Hz, 1H), 7.15–7.17 (m, 1H), 7.25–7.38 (m, 5H), 7.39 (d, $J=4.6$ Hz, 2H), 7.57 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.37 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.81 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 495 ($M^+ + 1$)

実施例 347 : イソプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-プロパノール (14 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を50 mg、収率75%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.34 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 6H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.04–5.07 (m, 1H), 6.38 (s, 1H), 6.58 (brs, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.46 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 412 (M^++1)

実施例 348 : シクロヘプチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘプチルメタノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を64 mg、収率77%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.23–1.31 (m, 2H), 1.45–1.60 (m, 6H), 1.70–1.89 (m, 5H), 4.01 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.70 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.80 (s, 1H), 7.18 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.61 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (t, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 452 (M^++1)

実施例 349 : シクロヘプチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶

解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘプチルメタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を64 mg、収率83%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.23–1.31 (m, 2 H), 1.47–1.59 (m, 6 H), 1.70–1.90 (m, 5 H), 2.13 (s, 3 H), 2.29 (s, 3 H), 4.01 (d, $J=6.8$ Hz, 2 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.43 (s, 1 H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.92 (brs, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.48 (t, $J=6.6$ Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 480 (M^++1)

実施例 350 : シクロヘプチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘプチルメタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を77 mg、収率100%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.19–1.31 (m, 2 H), 1.40–1.90 (m, 11 H), 2.10 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.01 (d, $J=6.8$ Hz, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.47 (s, 1 H), 6.57 (d, $J=6.1$ Hz, 1 H), 7.02 (d, $J=9.0$ Hz, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.

7.4 (brs, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.50 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 480 (M⁺+1)

実施例 351 : シクロヘプチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘプチルメタノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を41 mg、収率46%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 1.22-1.30 (m, 2H), 1.46-1.88 (m, 11H), 4.00 (d, J=6.8 Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 6.78 (s, 1H), 7.20 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.58 (d, J=9.0 Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 453 (M⁺+1)

実施例 352 : シクロヘプチルメチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロヘプチルメタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を53 mg、収率63%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 1.23-1.31 (m, 2

H), 1.47–1.91 (m, 11H), 4.02 (d, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 1H), 7.33 (d, $J=2.7\text{ Hz}$, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.39 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 487 (M^++1)

実施例 353: 2-シクロヘキシルエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 2-シクロヘキシル-1-エタノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 63 mg、収率 76% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz): δ 0.95–1.01 (m, 2H), 1.15–1.27 (m, 3H), 1.40–1.43 (m, 1H), 1.57–1.77 (m, 7H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.24 (t, $J=6.8\text{ Hz}$, 2H), 6.70 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.82 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.61 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (t, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 452 (M^++1)

実施例 354: 2-シクロヘキシルエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間

加熱還流した。次に2-シクロヘキシル-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を68 mg、収率88%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.94–1.02 (m, 2 H), 1.16–1.28 (m, 3 H), 1.40–1.44 (m, 1 H), 1.58–1.78 (m, 7 H), 2.13 (s, 3 H), 2.29 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.25 (t, $J=6.8$ Hz, 2 H), 6.42 (s, 1 H), 6.59 (d; $J=6.6$ Hz, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.91 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.49 (t, $J=6.3$ Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 480 (M^++1)

実施例355 : 2-シクロヘキシルエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-シクロヘキシル-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を65 mg、収率84%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.93–1.01 (m, 2 H), 1.16–1.24 (m, 3 H), 1.27–1.42 (m, 1 H), 1.51–1.77 (m, 7 H), 2.10 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.24 (t, $J=6.8$ Hz, 2 H), 6.45 (s, 1 H), 6.56 (d, $J=6.6$ Hz, 1 H), 7.02 (d, $J=8.8$ Hz, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.74 (br s,

1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.49 (t, $J=6.6$ Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 480 (M^++1)

実施例 356: 2-シクロヘキシルエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 2-シクロヘキシル-1-エタノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 48 mg、収率 54% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-}d_1$, 400 MHz): δ 0.95–1.01 (m, 2 H), 1.15–1.27 (m, 3 H), 1.41–1.77 (m, 8 H), 4.12 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 4.23 (t, $J=6.8$ Hz, 2 H), 6.76 (s, 1 H), 7.20 (d, $J=9.0$ Hz, 1 H), 7.58 (d, $J=8.5$ Hz, 1 H), 7.62 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 453 (M^++1)

実施例 357: 2-シクロヘキシルエチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 2-シクロヘキシル-1-エタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 56 mg、収率 67% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.96–1.02 (m, 2 H), 1.16–1.28 (m, 3 H), 1.42–1.78 (m, 8 H), 4.12 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 4.26 (t, $J=6.8$ Hz, 2 H), 7.18 (s, 1 H), 7.20 (d, $J=2.7$ Hz, 1 H), 7.33 (d, $J=2.7$ Hz, 1 H), 7.59 (s, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 8.39 (d, $J=9.0$ Hz, 1 H), 8.83 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 487 (M^++1)

実施例 358 : 1-エチルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ペンタノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を40 mg、収率53%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.96 (t, $J=7.6$ Hz, 6 H), 1.62–1.71 (m, 4 H), 4.10 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.75–4.79 (m, 1 H), 6.70 (d, $J=6.6$ Hz, 1 H), 6.80 (s, 1 H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H), 7.62 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 8.14 (s, 1 H), 8.49 (t, $J=6.6$ Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 412 (M^++1)

実施例 359 : 1-エチルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間

加熱還流した。次に3-ペンタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を53 mg、収率74%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.97 (t, $J=7.6$ Hz, 6H), 1.59–1.70 (m, 4H), 2.13 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.76–4.79 (m, 1H), 6.43 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.46 (t, $J=6.6$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 440 (M^++1)

実施例 360 : 1-エチルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ペンタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率87%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.97 (t, $J=7.6$ Hz, 6H), 1.59–1.70 (m, 4H), 2.10 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.76–4.79 (m, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 7.02 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.78 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.46 (t, $J=6.6$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 440 ($M^+ + 1$)

実施例 361 : 1-エチルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ペンタノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を55 mg、収率67%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.95 (t, $J=7.6$ Hz, 6H), 1.59–1.69 (m, 4H), 4.13 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.75–4.78 (m, 1H), 6.75 (s, 1H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 413 ($M^+ + 1$)

実施例 362 : 1-エチルプロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ペンタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を49 mg、収率63%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.97 (t, $J=7.6$ Hz, 6H), 1.58–1.69 (m, 4H), 4.12 (s, 3H), 4.2

0 (s, 3H), 4.77–4.80 (m, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.33 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.42 (d, $J=9.0$ Hz, 1H), 8.82 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 447 (M^++1)

実施例 363 : シクロペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (22 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を40 mg、収率53%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz): δ 1.60–1.94 (m, 8H), 4.10 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.23–5.24 (m, 1H), 6.69 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 7.17 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (t, $J=6.3$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 410 (M^++1)

実施例 364 : シクロペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮

し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を70mg、収率99%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.58–1.96 (m, 8H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.22–5.23 (m, 1H), 6.38 (s, 1H), 6.58 (d, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 438 (M^++1)

実施例365 : シクロペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (20mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62mg、収率84%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.66–1.95 (m, 8H), 2.10 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 5.21–5.25 (m, 1H), 6.41 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 7.01 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.78 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.47 (t, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 438 (M^++1)

実施例366 : シクロペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエ

ン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (22 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率76%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.49–1.93 (m, 8 H), 4.12 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 5.22–5.23 (m, 1 H), 6.71 (s, 1 H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.57 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 410 ($M^+ + 1$)

実施例367 : シクロペンチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率80%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.49–1.99 (m, 8 H), 4.12 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 5.23–5.27 (m, 1 H), 7.13 (s, 1 H), 7.19 (dd, $J=2.9, 9.0$ Hz, 1 H), 7.32 (d, $J=2.7$ Hz, 1 H), 7.59 (s, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 8.40 (d, $J=9.0$ Hz, 1 H), 8.82 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 445 ($M^+ + 1$)

実施例 368 : 1-ブチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に5-ノナノール (38 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を2 mg、収率2%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.92 (t, $J=7.1$ Hz, 6H), 1.31-1.39 (m, 8H), 1.57-1.64 (m, 4H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.85-4.91 (m, 1H), 6.69 (d, $J=6.8$ Hz, 1H), 7.18 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (d, $J=3.9$ Hz, 1H), 8.46 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 468 ($M^+ + 1$)

実施例 369 : 1-ブチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に5-ノナノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を56 mg、収率70%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.93 (t, $J=7.1$ Hz

z, 6 H), 1.37–1.39 (m, 8 H), 1.61 (brs, 1 H), 2.13 (s, 3 H), 2.29 (s, 3 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.87–4.90 (m, 1 H), 6.41 (s, 1 H), 6.58 (d, J=6.6 Hz, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.97 (s, 1 H), 8.15 (d, J=3.9 Hz, 1 H), 8.46 (t, J=6.3 Hz, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 496 (M⁺+1)

実施例 370 : 1-ブチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に5-ノナノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を57 mg、収率72%で得た。

¹H-NMR (CDCl₃-d₁, 400 MHz) : δ 0.92 (t, J=7.1 Hz, 6 H), 1.36 (brs, 8 H), 1.56–1.60 (m, 4 H), 2.10 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.12 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.87–4.90 (m, 1 H), 6.42 (s, 1 H), 6.55 (d, J=6.1 Hz, 1 H), 7.02 (d, J=8.8 Hz, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.80 (brs, 1 H), 8.16 (d, J=3.9 Hz, 1 H), 8.45 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 496 (M⁺+1)

実施例 371 : 1-ブチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、

塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 5-ノナノール (38 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 40 mg、収率 44% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.90–0.93 (m, 6 H), 1.34–1.35 (m, 8 H), 1.59 (brs, 4 H), 4.13 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 4.86–4.89 (m, 1 H), 6.71 (s, 1 H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.59 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 469 ($M^+ + 1$)

実施例 372 : 1-ブチルベンチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 5-ノナノール (33 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 42 mg、収率 49% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.92 (t, $J=7.1$ Hz, 6 H), 1.36 (brs, 8 H), 1.61 (brs, 4 H), 4.13 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 4.88–4.91 (m, 1 H), 7.17 (s, 1 H), 7.20 (s, 1 H), 7.33 (s, 1 H), 7.59 (s, 1 H), 8.17 (s, 1 H), 8.43 (d, $J=9.0$ Hz, 1 H), 8.82 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 503 ($M^+ + 1$)

実施例 373 : アリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-プロペン-1-オール (13 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を56 mg、収率84%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.71 (d, $J=5.9$ Hz, 2H), 5.32 (dd, $J=1.2, 10.5$ Hz, 1H), 5.40 (dd, $J=1.5, 17.3$ Hz, 1H), 5.96-6.06 (m, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.59 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.16 (d, $J=3.9$ Hz, 1H), 8.49 (t, $J=7.3$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 410 ($M^+ + 1$)

実施例 374 : アリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-プロペン-1-オール (13 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の

化合物を 50 mg、収率 75% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.10 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.71 (d, $J=5.9$ Hz, 2H), 5.31 (d, $J=10.2$ Hz, 1H), 5.40 (d, $J=17.3$ Hz, 1H), 5.96–6.04 (m, 1H), 6.50 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.1$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.16 (d, $J=3.9$ Hz, 1H), 8.48 (t, $J=6.6$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 410 (M^++1)

実施例 375 : アリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次に 2-プロペン-1-オール (15 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 42 mg、収率 54% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 4.13 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.70 (d, $J=5.9$ Hz, 2H), 5.29 (dd, $J=1.2, 10.5$ Hz, 1H), 5.39 (dd, $J=1.5, 17.3$ Hz, 1H), 5.93–6.03 (m, 1H), 6.81–6.87 (m, 1H), 7.20 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 382 (M^++1)

実施例 376 : 3-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン

(5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-フェニル-1-プロパノール (35 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を54 mg、収率64%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.01–2.08 (m, 2H), 2.75 (t, $J=8.1$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.24 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 6.70 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.80 (s, 1H), 7.17–7.33 (m, 7H), 7.61 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (d, $J=3.7$ Hz, 1H), 8.50 (t, $J=6.8$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 460 (M^++1)

実施例 377 : 3-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-フェニル-1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を77 mg、収率98%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 2.02–2.09 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.76 (t, $J=7.8$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.25 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 6.41 (s, 1H), 6.59 (d, $J=6.3$ Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.22–7.33 (m, 5H), 7.6

5 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.15 (d, $J=3.7$ Hz, 1H), 8.49 (t, $J=6.8$ Hz, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 488 (M^++1)

実施例 378: 3-フェニルプロピル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-フェニル-1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を56 mg、収率71%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz): δ 2.01–2.09 (m, 2H), 2.11 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.75 (t, $J=8.1$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.24 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.56 (d, $J=6.6$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 7.21–7.33 (m, 5H), 7.67 (s, 1H), 7.75 (br s, 1H), 8.16 (d, $J=3.9$ Hz, 1H), 8.49 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 488 (M^++1)

実施例 379: 3-フェニルプロピル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-フェニル-1-プロパノール (31 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、

濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 42 mg、収率 49% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 2.04–2.08 (m, 2H), 2.76 (t, $J=8.3$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.26 (t, $J=6.6$ Hz, 2H), 7.18–7.34 (m, 8H), 7.59 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.38 (d, $J=8.8$ Hz, 1H), 8.83 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 495 (M^++1)

実施例 380 : シクロプロピルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にシクロプロピルメタノール (19 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 25 mg、収率 34% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 0.33–0.37 (m, 2H), 0.60–0.65 (m, 2H), 1.18–1.22 (m, 1H), 4.04 (d, $J=7.3$ Hz, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.18 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.61 (d, $J=8.3$ Hz, 2H), 7.65 (s, 1H), 8.14 (s, 3H), 8.51 (br s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 395 (M^++1)

実施例 381 : シクロプロピルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶

解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロプロピルメタノール (17 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を51 mg、収率74%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.34–0.38 (m, 2 H), 0.61–0.66 (m, 2 H), 1.18–1.24 (m, 1 H), 2.13 (s, 3 H), 2.30 (s, 3 H), 4.04 (d, $J=7.3$ Hz, 2 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.47 (s, 1 H), 6.59 (s, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.92 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.48 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 424 ($M^+ + 1$)

実施例382 : シクロプロピルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロプロピルメタノール (17 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を55 mg、収率80%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.34–0.38 (m, 2 H), 0.61–0.66 (m, 2 H), 1.19–1.23 (m, 1 H), 2.11 (s, 3 H), 2.28 (s, 3 H), 4.04 (d, $J=7.3$ Hz, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.50 (s, 1 H), 6.56 (s, 1 H), 7.03 (d, $J=8.8$ Hz, 1 H), 7.67 (s, 1 H), 7.78 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.48 (brs, 1

H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 424 ($M^+ + 1$)

実施例 383 : シクロプロピルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロプロピルメタノール (19 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を60 mg、収率75%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-}d_1$, 400 MHz) : δ 0.33-0.36 (m, 2H), 0.59-0.64 (m, 2H), 1.16-1.23 (m, 1H), 4.03 (d, $J=7.6$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 6.81 (s, 1H), 7.20 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.57 (d, $J=8.5$ Hz, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 8.77 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 396 ($M^+ + 1$)

実施例 384 : シクロプロピルメチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロプロピルメタノール (17 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を49 mg、収率65%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.34–0.38 (m, 2 H), 0.62–0.66 (m, 2 H), 1.20–1.24 (m, 1 H), 4.06 (d, $J=7.3$ Hz, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 7.19–7.21 (m, 2 H), 7.33 (s, 1 H), 7.59 (s, 1 H), 8.17 (s, 1 H), 8.40 (d, $J=8.8$ Hz, 1 H), 8.83 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 431 (M^++1)

実施例 385 : シクロブチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にシクロブチルメタノール (22 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 48 mg、収率 64% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.80–2.13 (m, 6 H), 2.65–2.71 (m, 1 H), 4.10 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.18 (d, $J=6.8$ Hz, 2 H), 6.70 (s, 1 H), 6.80 (s, 1 H), 7.18 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H), 7.60 (d, $J=8.5$ Hz, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 8.14 (s, 1 H), 8.50 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 410 (M^++1)

実施例 386 : シクロブチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間

加熱還流した。次にシクロブチルメタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を61 mg、収率86%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.81–1.99 (m, 4 H), 2.05–2.20 (m, 2 H), 2.13 (s, 3 H), 2.29 (s, 3 H), 2.66–2.73 (m, 1 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 4.19 (d, $J=7.1$ Hz, 2 H), 6.43 (s, 1 H), 6.60 (s, 1 H), 7.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.91 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.49 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 438 (M^++1)

実施例387 : シクロブチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロブチルメタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を59 mg、収率83%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.78–2.08 (m, 6 H), 2.08 (s, 3 H), 2.26 (s, 3 H), 2.60–2.70 (m, 1 H), 4.09 (s, 3 H), 4.15 (s, 3 H), 4.16 (d, $J=6.8$ Hz, 2 H), 6.43 (s, 1 H), 6.55 (s, 1 H), 7.00 (d, $J=8.5$ Hz, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.74 (brs, 1 H), 8.13 (s, 1 H), 8.47 (brs, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 438 (M^++1)

実施例 388 : シクロブチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、 トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にシクロブチルメタノール (22 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 55 mg 、収率 67 % で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.80–1.99 (m, 4 H) , 2.07–2.14 (m, 2 H) , 2.64–2.71 (m, 1 H) , 4.12 (s, 3 H) , 4.17 (d, $J=6.8$ Hz, 2 H) , 4.19 (s, 3 H) , 6.79 (s, 1 H) , 7.20 (d, $J=8.8$ Hz, 2 H) , 7.58 (d, $J=8.3$ Hz, 2 H) , 7.62 (s, 1 H) , 8.11 (s, 1 H) , 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 410 (M^++1)

実施例 389 : シクロブチルメチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、 トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にシクロブチルメタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 46 mg 、収率 59 % で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.81–2.01 (m, 4 H) , 2.09–2.17 (m, 2 H) , 2.66–2.74 (m, 1 H) , 4.

1.2 (s, 3H), 4.20 (d, $J=6.8$ Hz, 2H), 4.20 (s, 3H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (d, $J=2.7$ Hz, 1H), 7.33 (d, $J=2.4$ Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.39 (d, $J=9.3$ Hz, 1H), 8.83 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 445 (M^++1)

実施例 390 : シクロヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 58 mg、収率 74% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.29–1.58 (m, 6H), 1.74–1.81 (m, 2H), 1.95–2.00 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.13 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.76–4.77 (m, 1H), 6.38 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 453 (M^++1)

実施例 391 : シクロヘキシル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロヘキサノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽

出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を50mg、収率64%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.21-1.57 (m, 6H), 1.73-1.79 (m, 2H), 1.94-2.00 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.14 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 4.70-4.80 (m, 1H), 6.40 (s, 1H), 7.01 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.78 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.78 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 453 (M^++1)

実施例392 : シクロペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (20mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を47mg、収率61%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.49-1.84 (m, 6H), 1.89-1.98 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.13 (s, 3H), 4.20 (s, 3H), 5.21-5.22 (m, 1H), 6.36 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 439 (M^++1)

実施例393 : シクロペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg)

g) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に1-シクロペンタノール (20 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を43 mg、収率56%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.49–1.83 (m, 6 H), 1.88–1.97 (m, 2 H), 2.08 (s, 3 H), 2.26 (s, 3 H), 4.14 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 5.20–5.25 (m, 1 H), 6.39 (s, 1 H), 7.01 (d, $J=8.8$ Hz, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.77 (brs, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 8.78 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 439 (M^++1)

実施例394 : シクロペンチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロペンチルメタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を42 mg、収率54%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.22–1.84 (m, 8 H), 2.25–2.29 (m, 1 H), 4.10–4.17 (m, 8 H), 6.69 (d, $J=6.1$ Hz, 1 H), 6.80 (s, 1 H), 7.18 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.61 (d, $J=8.5$ Hz, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.47 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 424 ($M^+ + 1$)

実施例 395 : シクロペンチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロペンチルメタノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を62 mg、収率85%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.31–1.68 (m, 6 H), 1.78–1.86 (m, 2 H), 2.13 (s, 3 H), 2.20–2.30 (m, 1 H), 2.29 (s, 3 H), 4.10 (d, $J=6.3$ Hz, 2 H), 4.11 (s, 3 H), 4.17 (s, 3 H), 6.42 (s, 1 H), 6.58 (d, $J=6.3$ Hz, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 7.65 (s, 1 H), 7.91 (s, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 8.46 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 452 ($M^+ + 1$)

実施例 396 : シクロペンチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次にシクロペンチルメタノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を48 mg、収率66%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.27–1.35 (m, 2

H), 1.55–1.67 (m, 4H), 1.76–1.84 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.26–2.30 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 4.09 (d, $J=7.1$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.18 (s, 3H), 6.44 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 7.03 (d, $J=8.5$ Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.76 (brs, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.45 (brs, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 452 (M^++1)

実施例 397: シクロペンチルメチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて 10 分間加熱還流した。次にシクロペンチルメタノール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で 3 時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1 規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 64 mg、収率 75% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 - d_1 , 400 MHz): δ 1.30–1.33 (m, 2H), 1.59–1.65 (m, 4H), 1.76–1.83 (m, 2H), 4.09 (d, $J=7.3$ Hz, 2H), 4.12 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 6.76 (s, 1H), 7.20 (d, $J=9.0$ Hz, 2H), 7.58 (d, $J=8.8$ Hz, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 425 (M^++1)

実施例 398: シクロペンチルメチル N-{2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

2-クロロ-4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて 10 分間

加熱還流した。次にシクロペンチルメタノール (23 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を47 mg、収率59%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 1.29–1.34 (m, 2 H), 1.57–1.66 (m, 4 H), 1.77–1.85 (m, 2 H), 4.11 (d, $J=7.1$ Hz, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.20 (s, 3 H), 7.19 (s, 1 H), 7.33 (d, $J=2.7$ Hz, 1 H), 7.59 (s, 1 H), 8.17 (s, 1 H), 8.39 (d, $J=9.0$ Hz, 1 H), 8.82 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 459 (M^++1)

実施例 399 : 2-モルホリノエチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-モルホリノ-1-エタノール (34 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を54 mg、収率60%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3-d_1 , 400 MHz) : δ 2.94–3.04 (m, 2 H), 3.30–3.36 (m, 2 H), 3.58–3.63 (m, 2 H), 4.01–4.07 (m, 2 H), 4.12 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 4.53–4.59 (m, 4 H), 7.19 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 7.67 (d, $J=9.0$ Hz, 2 H), 8.14 (s, 1 H), 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 456 (M^++1)

実施例 400 : 1-プロピルブチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に4-ヘプタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 53 mg、収率 61% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.95 (t, $J=7.3\text{ Hz}$, 6 H), 1.19–1.62 (m, 8 H), 4.13 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 4.90–4.93 (m, 1 H), 6.72 (s, 1 H), 7.19 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2 H), 7.58 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 8.15 (s, 1 H), 8.80 (s, 1 H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 441 (M^++1)

実施例 401 : 1-エチルペンチル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml) 、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に3-ヘプタノール (30 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を 63 mg、収率 72% で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 0.92–0.97 (m, 6 H), 1.34–1.67 (m, 8 H), 4.13 (s, 3 H), 4.19 (s, 3 H), 4.81–4.84 (m, 1 H), 6.72 (s, 1 H), 7.19

(d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.58 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 441 (M^++1)

実施例 402: 2-(tert-ブチル)フェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-(tert-ブチル)フェノール (39 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を74 mg、収率80%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz): δ 1.41 (s, 9H), 4.13 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 7.08–7.11 (m, 1H), 7.19–7.29 (m, 5H), 7.41–7.44 (m, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.70 (d, $J=8.5\text{ Hz}$, 2H), 8.15 (s, 1H), 8.79 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z): 475 (M^++1)

実施例 403: 2-メトキシフェニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メトキシフェノール (32 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を16 mg、収率18%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 3.87 (s, 3H), 4.13 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 6.97–7.02 (m, 2H), 7.15–7.26 (m, 5H), 7.62 (s, 1H), 7.66 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 448 (M^++1)

実施例 404 : 2-メチルアリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メチル-2-プロペン-1-オール (19 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を38 mg、収率52%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.82 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.63 (s, 2H), 4.99 (s, 1H), 5.06 (s, 1H), 6.70 (d, $J=6.3\text{ Hz}$, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.19 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.62 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.48 (t, $J=6.6\text{ Hz}$, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 395 (M^++1)

実施例 405 : 2-メチルアリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,5-ジメチルアニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メチル-2-プロペン-1-オール (17 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルム

で抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を31mg、収率45%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.83 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.64 (s, 2H), 5.00 (s, 1H), 5.06 (s, 1H), 6.59 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.46 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 424 (M^++1)

実施例406 : 2-メチルアリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルフェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]-2,3-ジメチルアニリン (50mg) をトルエン (5ml)、トリエチルアミン (0.5ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (68mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メチル-2-プロペン-1-オール (17mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残査をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を40mg、収率58%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400MHz) : δ 1.83 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.12 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.63 (s, 2H), 5.00 (s, 1H), 5.06 (s, 1H), 6.56 (d, $J=5.9\text{ Hz}$, 1H), 7.03 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 1H), 7.67 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.46 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 424 (M^++1)

実施例407 : 2-メチルアリル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キナゾリニル)オキシ]アニリン (50mg) をトルエ

ン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に2-メチル-2-プロペン-1-オール (19 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を37 mg、収率47%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 4.13 (s, 3H), 4.19 (s, 3H), 4.62 (s, 2H), 4.98 (s, 1H), 5.05 (s, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.21 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.62 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.80 (s, 1H)

質量分析値 (ESI-MS, m/z) : 396 (M^++1)

実施例 408 : 1-エチル-3-ブチニル N-{4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]フェニル}カーバメート

4-[(6,7-ジメトキシ-4-キノリル)オキシ]アニリン (50 mg) をトルエン (5 ml)、トリエチルアミン (0.5 ml) に加え加熱還流して溶解した後、塩化メチレンに溶解したトリホスゲン (77 mg) を加えて10分間加熱還流した。次に5-ヘキシ-3-オール (26 mg) を加えて、さらに加熱還流下で3時間攪拌した。飽和重曹水で反応を停止した後、クロロホルムで抽出し、1規定塩酸、水、飽和食塩水の順で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムで精製することにより、表題の化合物を30 mg、収率39%で得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{CDCl}_3\text{-d}_1$, 400 MHz) : δ 1.01 (t, $J=7.6\text{ Hz}$, 3H), 1.79-1.83 (m, 2H), 2.04-2.05 (m, 1H), 2.57-2.61 (m, 2H), 4.11 (s, 3H), 4.17 (s, 3H), 4.90-4.93 (m, 1H), 6.69 (d, $J=6.1\text{ Hz}$, 1H), 6.83 (s, 1H), 7.19 (d, $J=9.0\text{ Hz}$, 2H), 7.61 (d, $J=8.8\text{ Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 8.15 (s, 1